

JP2000001460A

2000-1-7

Bibliographic Fields

Document Identity

(19)【発行国】	(19) [Publication Office]
日本国特許庁 (JP)	Japan Patent Office (JP)
(12)【公報種別】	(12) [Kind of Document]
公開特許公報 (A)	Unexamined Patent Publication (A)
(11)【公開番号】	(11) [Publication Number of Unexamined Application]
特開2000-1460 (P2000-1460A)	Japan Unexamined Patent Publication 2000- 1460 (P2000-1460A)
(43)【公開日】	(43) [Publication Date of Unexamined Application]
平成12年1月7日 (2000. 1. 7)	2000 January 7* (2000.1.7)

Public Availability

(43)【公開日】	(43) [Publication Date of Unexamined Application]
平成12年1月7日 (2000. 1. 7)	2000 January 7* (2000.1.7)

Technical

(54)【発明の名称】	(54) [Title of Invention]
アクリル酸誘導体及びその用途	ACRYLIC ACID DERIVATIVE AND ITS APPLICATION
(51)【国際特許分類第7版】	(51) [International Patent Classification, 7th Edition]
C07C 69/618	C07C 69/618
A01N 39/00	A01N 39/00
43/40 101	43/40 101
43/54	43/54
C07D207/30	C07D207/30
213/30	213/30
213/32	213/32
213/38	213/38
213/64	213/64
215/14	215/14
237/14	237/14
239/34	239/34
239/38	239/38
277/28	277/28
307/42	307/42
333/16	333/16
333/20	333/20

333/54	333/54
333/58	333/58
401/04 213	401/04 213
405/04 213	405/04 213
409/04 213	409/04 213
【FI】	[FI]
C07C 69/618	C07C 69/618
A01N 39/00 A	A01N 39/00 A
43/40 101 E	43/40 101 E
43/54 A	43/54 A
C07D207/30	C07D207/30
213/30	213/30
213/32	213/32
213/38	213/38
213/64	213/64
215/14	215/14
237/14	237/14
239/34	239/34
239/38	239/38
277/28	277/28
307/42	307/42
333/16	333/16
333/20	333/20
333/54	333/54
333/58	333/58
401/04 213	401/04 213
405/04 213	405/04 213
409/04 213	409/04 213
【請求項の数】	[Number of Claims]
9	9
【出願形態】	[Form of Application]
OL	OL
【全頁数】	[Number of Pages in Document]
69	69
【テーマコード(参考)】	[Theme Code (For Reference)]

4C0234C0314C0334C0374C0554C0634C0694H011

【F ターム(参考)】

4C023 BA07 CA07 4C031 BA09 4C033 AD09
4C037 HA01 HA08 4C055 AA01 BA01 BA08
BA16 BA21 BA27 BA42 BA47 BB02 BB04
BB08 BB09 BB10 BB11 CA01 CA08 CA16
CA21 CA27 CB02 CB11 DA01 DA08 DA16
DA21 DA27 DB02 DB11 4C063 AA01 BB01
BB03 BB08 CC12 CC14 CC22 CC28 CC29
CC52 CC62 CC75 CC92 CC94 DD04 DD06
DD11 DD12 DD14 DD29 EE03 4C069 AB03
BB08 BB16 BB25 BB34 4H011 AA01

Filing

【審査請求】

未請求

(21)【出願番号】

特願平10-163873

(22)【出願日】

平成10年6月11日(1998. 6. 11)

Parties

Applicants

(71)【出願人】

【識別番号】

000002093

【氏名又は名称】

住友化学工業株式会社

【住所又は居所】

大阪府大阪市中央区北浜4丁目5番33号

Inventors

(72)【発明者】

【氏名】

広瀬 太郎

【住所又は居所】

兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化学工業株式会社内

Agents

(74)【代理人】

【識別番号】

4C0234C0314C0334C0374C0554C0634C0694H011

[F Term (For Reference)]

4C023 BA 07 CA07 4C031 BA 09 4C033 AD09 4C037
HA01 HA08 4C055 AA01 BA 01 BA 08 BA 16 BA 21 BA
27 BA 42 BA 47 BB02 BB04 BB08 BB09 BB10 BB11 CA01
CA08 CA16 CA21 CA27 CB02 CB11 DA01 DA08 DA16
DA21 DA27 DB02 DB11 4C063 AA01 BB01 BB03 BB08
CC12 CC14 CC22 CC28 CC29 CC52 CC62 CC75 CC92
CC94 DD04 DD06 DD11 DD12 DD14 DD29 EE03 4C069
AB03 BB08 BB16 BB25 BB34 4H011 AA01

[Request for Examination]

Unrequested

(21) [Application Number]

Japan Patent Application Hei 10- 163873

(22) [Application Date]

1998 June 11* (1998.6.11)

(71) [Applicant]

[Identification Number]

000002093

[Name]

SUMITOMO CHEMICAL CO. LTD. (DB 69-053-5307)

[Address]

Osaka Prefecture Osaka City Chuo-ku Kitahama 4-5-33

(72) [Inventor]

[Name]

Hirose Taro

[Address]

Hyogo Prefecture Takarazuka City Takashi 4-2-1 Sumitomo Chemical Co. Ltd. (DB 69-053-5307) *

(74) [Attorney(s) Representing All Applicants]

[Identification Number]

100093285

【弁理士】

【氏名又は名称】

久保山 隆（外1名）

Abstract

(57)【要約】

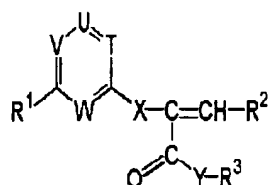
【課題】

優れた農園芸用殺菌効力を有する化合物を提供すること

【解決手段】

一般式 化 1

【化 1】



〔式中、 R^1 は置換されていてもよいアルキル基等を表わし、 R^2 は塩素原子または臭素原子を表わし、 R^3 は置換されていてもよいアルキル基を表わし、T、U 及び V の内、一つは CR^4 基を表わし、他の一つは CH 基または窒素原子を表わし、また、残りの一つは CR^5 基または窒素原子を表わし、W は CR^{44} 基または窒素原子を表わす。 R^4 、 R^5 及び R^{44} は同一または相異なり、水素原子等を表し、X は酸素原子等を表し、Y は酸素原子を表わす。〕で示されるアクリル酸誘導体。

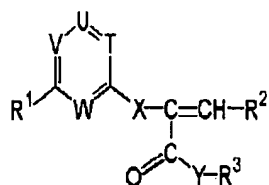
Claims

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 化 1

【化 1】



100093285

[Patent Attorney]

[Name]

Kuboyama Takashi (1 other)

(57) [Abstract]

[Problems to be Solved by the Invention]

Offer compound which possesses horticultural sterilization effectiveness which is superior

[Means to Solve the Problems]

General Chemical Formula 1

[Chemical Formula 1]

acrylic acid derivative . which is shown with {In Formula, $R^{¹}$ displays optionally substitutable alkyl group etc, $R^{²}$ displays the chlorine atom or bromine atom , $R^{³}$ displays optionally substitutable alkyl group , inside T, U and V, one displays $CR^{⁴}$ basis, other one CH group or displays nitrogen atom , in addition, remaining one $CR^{⁵}$ basis or displays nitrogen atom , W $CR^{⁴⁴}$ basis or displays nitrogen atom . Displays $R^{⁴}$, $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$ identical or different , hydrogen atom etc, X displays the oxygen atom etc, Y displays oxygen atom . }

[Claim(s)]

[Claim 1]

General Chemical Formula 1

[Chemical Formula 1]

[式中、 R^1 は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルケニルアルキル基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいアリールアルキル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよいヘテロアリールアルキル基、 A^1-L^1 -基、 $A^1-ON=CA^2$ -基、 $A^1SC(A^2)=N$ -基または $A^1SC(SA^2)=N$ -基[ここで、 L^1 は酸素原子、硫黄原子、NH基、またはアルキルイミノ基を表わし、 A^1 及び A^2 は同一または相異なり、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルケニルアルキル基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいアリールアルキル基、置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールアルキル基を表わす。]を表わし、 R^2 は塩素原子または臭素原子を表わし、 R^3 は置換されていてもよいアルキル基を表わし、T、U及びVの内、一つは CR^4 基を表わし、他の一つはCH基または窒素原子を表わし、また、残りの一つは CR^5 基または窒素原子を表わし、Wは CR^{44} 基または窒素原子を表わす。 R^4 、 R^5 及び R^{44} は同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基、ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アルコキシカルボニル基、アルキルチオ基またはハロアルキルチオ基を表し、Xは NR^6 基、酸素原子または硫黄原子を表し、 R^6 は置換されていてもよいアルキル基を表す。但しXが硫黄原子である場合、 R^1 基はアルキル基ではない。Yは酸素原子を表わす。]

で示されるアクリル酸誘導体。

【請求項2】

上記一般式 化1における R^1 、 A^1 または A^2 において、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルケニルアルキル基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいアリールアルキ

{In Formula, $R^{¹}$ optionally substitutable alkyl group, optionally substitutable alkenyl group, optionally substitutable alkynyl group, optionally substitutable cycloalkyl group, optionally substitutable cycloalkyl alkyl group, optionally substitutable cycloalkenyl group, optionally substitutable cycloalkenyl alkyl group, optionally substitutable aryl group, optionally substitutable arylalkyl basis, optionally substitutable heteroaryl group, optionally substitutable heteroaryl alkyl group, $A^{¹}-L^{¹}$ - basis and $A^{¹}-ON=CA^{²}$ - basis, the $A^{¹}SC(A^{²})=N$ - basis or $A^{¹}SC(SA^{²})=N$ - to display basic {Here, $L^{¹}$ displays oxygen atom, sulfur atom, NH group, or alkyl imino group, $A^{¹}$ and the $A^{²}$ identical or different, optionally substitutable alkyl group, optionally substitutable alkenyl group, optionally substitutable alkynyl group, optionally substitutable cycloalkyl group, optionally substitutable cycloalkyl alkyl group, optionally substitutable cycloalkenyl group, optionally substitutable cycloalkenyl alkyl group, optionally substitutable aryl group, optionally substitutable arylalkyl basis, display optionally substitutable heteroaryl group or optionally substitutable heteroaryl alkyl group. }, $R^{²}$ to display chlorine atom or bromine atom, $R^{³}$ to display optionally substitutable alkyl group, inside T, U and V, one to display $CR^{⁴}$ basis, other one to display CH group or nitrogen atom, in addition, Remaining one displays $CR^{⁵}$ basis or nitrogen atom, W displays $CR^{⁴⁴}$ basis or nitrogen atom. $R^{⁴}$, $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$ display identical or different, hydrogen atom, halogen atom, alkyl group, alkoxy group, haloalkyl group, haloalkoxy group, cyano group, nitro group, alkoxy carbonyl group, alkyl thio group or haloalkyl thio group, $XNR^{⁶}$ basis, displays oxygen atom or sulfur atom, $R^{⁶}$ displays optionally substitutable alkyl group. However when X is sulfur atom, $R^{¹}$ basis is not alkyl group. Y displays oxygen atom. }

So acrylic acid derivative . which is shown

[Claim 2]

In $R^{¹}$, $A^{¹}$ or $A^{²}$ in above-mentioned General Chemical Formula 1, optionally substitutable alkyl group, optionally substitutable alkenyl group, optionally substitutable alkynyl group, optionally substitutable cycloalkyl group, optionally substitutable cycloalkyl alkyl group, optionally substitutable cycloalkenyl group, optionally substitutable cycloalkenyl alkyl group, optionally substitutable aryl group, optionally substitutable arylalkyl basis, each substituent in optionally substitutable

ル基、置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールアルキル基における各置換基が、同一または相異なり、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、ハロアルキルチオ基、アルキルアミノ基、ジアルキルアミノ基、アルコキシカルボニル基、ハロアルコキシカルボニル基、アルキルアミノカルボニル基、ジアルキルアミノカルボニル基、アシルアミノ基、アルコキシカルボニルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群より選ばれる 1 種以上である請求項 1 に記載のアクリル酸誘導体。

【請求項 3】

上記一般式 化 1 における R^1 が、置換されていてもよい C1~C10 アルキル基、置換されていてもよい C2~C10 アルケニル基、置換されていてもよい C2~C10 アルキニル基、置換されていてもよい C3~C10 シクロアルキル基、置換されていてもよい C4~C20 シクロアルキルアルキル基、置換されていてもよい C5~C10 シクロアルケニル基、置換されていてもよい C6~C20 シクロアルケニルアルキル基、置換されていてもよい C6~C10 アリール基、置換されていてもよい C7~C20 アリールアルキル基、置換されていてもよい C1~C9 ヘテロアリール基、置換されていてもよい C2~C19 ヘテロアリールアルキル基、 A^1-L^1 -基、 $A^1-ON=CA^2$ -基、 $A^1SC(A^2)=N$ -基または $A^1SC(SA^2)=N$ -基

[ここで、 L^1 は酸素原子、硫黄原子、NH 基、またはアルキルイミノ基であり、 A^1 及び A^2 は同一または相異なり、置換されていてもよい C1~C10 アルキル基、置換されていてもよい C2~C10 アルケニル基、置換されていてもよい C2~C10 アルキニル基、置換されていてもよい C3~C10 シクロアルキル基、置換されていてもよい C4~C20 シクロアルキルアルキル基、置換されていてもよい C5~C10 シクロアルケニル基、置換されていてもよい C6~C20 シクロアルケニルアルキル基、置換されていてもよい C6~C10 アリール基、置換されていてもよい C7~C20 アリールアルキル基、置換されていてもよい C1~C9 ヘテロアリール基または置換されていてもよい C2~C19 ヘテロアリールアルキル基である。]であり、 R^3 が C1~C5 アルキル基であり、 R^4 、 R^5 及び R^{44} が同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、C1~C10 アルキル基、C1~C10 アルコキシ基、C1~C10 ハロアルキル基、C1~C10 ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C1~C10 アルコキシカルボニル基、C1~C10 アルキルチオ基または C1~C10 ハロアルキルチオ基であり、 R^6 が C1~C10 アルキル基である請求項 1 に記載の

heteroaryl group or optionally substitutable heteroaryl alkyl group, from group which consists of identical or different, halogen atom, alkyl group, haloalkyl group, cycloalkyl group, alkoxy group, haloalkoxy group, alkyl thio group, haloalkyl thio group, alkyl amino group, dialkyl amino group, alkoxy carbonyl group, haloalkoxy carbonyl group, alkyl amino carbonyl group, dialkyl amino carbonyl group, acyl amino group, alkoxy carbonyl amino group, cyano group and nitro group acrylic acid derivative. which is stated in Claim 1 which is a one kind or more which is chosen

[Claim 3]

$R^{¹}$ in above-mentioned General Chemical Formula 1, optionally substitutable C1~C10alkyl group, optionally substitutable C2~C10alkenyl group, optionally substitutable C2~C10alkynyl group, optionally substitutable C3~C10cycloalkyl group, optionally substitutable C4~C20cycloalkyl alkyl group, optionally substitutable C5~C10cycloalkenyl group, optionally substitutable C6~C20cycloalkenyl alkyl group, optionally substitutable C6~C10aryl group, optionally substitutable C7~C20arylalkyl basis, optionally substitutable C1~C9heteroaryl group, optionally substitutable C2~C19heteroaryl alkyl group, $A^{¹}-L^{¹}$ - basis and $A^{¹}-ON=CA^{²}$ - basis, $A^{¹}SC(A^{²})=N$ - basis or $A^{¹}SC(SA^{²})=N$ - basis

With {Here, as for $L^{¹}$ with oxygen atom, sulfur atom, NH group, or alkyl imino group, as for $A^{¹}$ and $A^{²}$ identical or different, optionally substitutable C1~C10alkyl group, optionally substitutable C2~C10alkenyl group, optionally substitutable C2~C10alkynyl group, optionally substitutable C3~C10cycloalkyl group, optionally substitutable C4~C20cycloalkyl alkyl group, optionally substitutable C5~C10cycloalkenyl group, optionally substitutable C6~C20cycloalkenyl alkyl group, optionally substitutable C6~C10aryl group, optionally substitutable C7~C20arylalkyl basis, it is a optionally substitutable C1~C9heteroaryl group or a optionally substitutable C2~C19heteroaryl alkyl group. }, $R^{³}$ being C1~C5alkyl group, $R^{⁴}$, $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$ with identical or different, hydrogen atom, halogen atom, C1~C10alkyl group, C1~C10alkoxy group, C1~C10haloalkyl group, C1~C10haloalkoxy group, cyano group, nitro group, C1~C10alkoxy carbonyl group, C1~C10alkyl thio group or C1~C10haloalkyl thio group, acrylic acid derivative. which is stated in Claim 1 where $R^{⁶}$ is C1~C10alkyl group

C1~C10 アルキル基である請求項 1 に記載のアクリル酸誘導体。

【請求項 4】

上記一般式 化 1 における R^1 、 A^1 または A^2 において、置換されていてもよい C1~C10 アルキル基、置換されていてもよい C2~C10 アルケニル基、置換されていてもよい C2~C10 アルキニル基、置換されていてもよい C3~C10 シクロアルキル基、置換されていてもよい C4~C20 シクロアルキルアルキル基、置換されていてもよい C5~C10 シクロアルケニル基、置換されていてもよい C6~C20 シクロアルケニルアルキル基、置換されていてもよい C6~C10 アリール基、置換されていてもよい C7~C20 アリールアルキル基、置換されていてもよい C1~C9 ヘテロアリール基、置換されていてもよい C2~C19 ヘテロアリールアルキル基における各置換基が、同一もしくは相異なり、ハロゲン原子、C1~C10 アルキル基、C1~C10 ハロアルキル基、C3~C10 シクロアルキル基、C1~C10 アルコキシ基、C1~C10 ハロアルコキシ基、C1~C10 アルキルチオ基、C1~C10 ハロアルキルチオ基、C1~C10 アルキルアミノ基、C2~C20 ジアルキルアミノ基、C2~C10 アルコキシカルボニル基、C2~C10 ハロアルコキシカルボニル基、C2~C10 アルキルアミノカルボニル基、C3~C10 ジアルキルアミノカルボニル基、C2~C10 アシルアミノ基、C2~C10 アルコキシカルボニルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群より選ばれる 1 種以上である請求項 1 または 3 に記載のアクリル酸誘導体。

【請求項 5】

上記一般式 化 1 において、 R^1 が $A^1\text{-ON}=\text{CA}^2\text{-}$ 基[ここで、 A^1 及び A^2 は同一または相異なり、置換されていてもよい C1~C10 アルキル基、置換されていてもよい C2~C10 アルケニル基、置換されていてもよい C2~C10 アルキニル基、置換されていてもよい C3~C10 シクロアルキル基、置換されていてもよい C4~C20 シクロアルキルアルキル基、置換されていてもよい C5~C10 シクロアルケニル基、置換されていてもよい C6~C20 シクロアルケニルアルキル基、置換されていてもよい C6~C10 アリール基、置換されていてもよい C7~C20 アリールアルキル基、置換されていてもよい C1~C9 ヘテロアリール基または置換されていてもよい C2~C19 ヘテロアリールアルキル基である。]である請求項 1 に記載のアクリル酸誘導体。

【請求項 6】

上記一般式 化 1 において、 R^3 がメチル基であり、 R^4 、 R^5 及び R^{44} が同一または相異なり、水素

[Claim 4]

In $R^{¹}$, $A^{¹}$ or $A^{²}$ in above-mentioned General Chemical Formula 1, optionally substitutable C1~C10alkyl group, optionally substitutable C2~C10alkenyl group, optionally substitutable C2~C10alkynyl group, optionally substitutable C3~C10cycloalkyl group, optionally substitutable C4~C20cycloalkyl alkyl group, optionally substitutable C5~C10cycloalkenyl group, optionally substitutable C6~C20cycloalkenyl alkyl group, optionally substitutable C6~C10aryl group, optionally substitutable C7~C20arylalkyl basis, from group where each substituent in optionally substitutable C1~C9heteroaryl group, optionally substitutable C2~C19heteroaryl alkyl group, becomes same or difference, consists of halogen atom, C1~C10alkyl group, C1~C10haloalkyl group, C3~C10cycloalkyl group, C1~C10alkoxy group, C1~C10haloalkoxy group, C1~C10alkyl thio group, C1~C10haloalkyl thio group, C1~C10alkyl amino group, C2~C20dialkyl amino group, C2~C10alkoxy carbonyl group, C2~C10haloalkoxy carbonyl group, C2~C10alkyl amino carbonyl group, C3~C10dialkyl amino carbonyl group, C2~C10acyl amino group, C2~C10alkoxy carbonyl amino group, cyano group and nitro group acrylic acid derivative. which is stated in Claim 1 or 3 which is a one kind or more which is chosen

[Claim 5]

In above-mentioned General Chemical Formula 1, acrylic acid derivative. which is stated in Claim 1 where $R^{¹}$ is $A^{¹}\text{-ON}=\text{CA}^{²}\text{-}$ basic {Here, $A^{¹}$ and $A^{²}$ identical or different, optionally substitutable C1~C10alkyl group, optionally substitutable C2~C10alkenyl group, optionally substitutable C2~C10alkynyl group, optionally substitutable C3~C10cycloalkyl group, optionally substitutable C4~C20cycloalkyl alkyl group, optionally substitutable C5~C10cycloalkenyl group, optionally substitutable C6~C20cycloalkenyl alkyl group, optionally substitutable C6~C10aryl group, optionally substitutable C7~C20arylalkyl basis, are optionally substitutable C1~C9heteroaryl group or optionally substitutable C2~C19heteroaryl alkyl group. }

[Claim 6]

In above-mentioned General Chemical Formula 1, $R^{³}$ being methyl group, $R^{⁴}$ and $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$ being same or different, hydrogen

原子、ハロゲン原子、C1~C10 アルキル基または C1~C10 ハロアルキル基であり、R⁶ がメチル基である請求項 1~5 のいずれかに記載のアクリル酸誘導体。

【請求項 7】

上記一般式 化 1 において、X が酸素原子である請求項 1~6 のいずれかに記載のアクリル酸誘導体。

【請求項 8】

上記一般式 化 1 において、T、U 及び V の内、一つが CR⁴ 基であり、他の一つが CH 基であり、また、残りの一つが CR⁵ 基であり、W が CR⁴⁴ 基である請求項 1~7 のいずれかに記載のアクリル酸誘導体。

【請求項 9】

請求項 1~8 のいずれかに記載のアクリル酸誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺菌剤。

Specification

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明はアクリル酸誘導体及びその用途に関する。

【0002】

【発明が解決しようとする課題】

本発明は優れた農園芸用殺菌効力を有する化合物を提供することを課題とする。

【0003】

【課題を解決するための手段】

本発明者らは、鋭意検討した結果、後記一般式 化 2 で示されるアクリル酸誘導体が優れた農園芸用殺菌効力を有することを見出し、本発明に至った。

即ち、本発明は、一般式 化 2

【化 2】

R⁵ and R⁴⁴ with identical or different, hydrogen atom, halogen atom, C1~C10alkyl group or C1~C10haloalkyl group, acrylic acid derivative, which is stated in any of Claim 1 ~5 where R⁶ is methyl group

[Claim 7]

In above-mentioned General Chemical Formula 1, acrylic acid derivative, which is stated in any of Claim 1 ~6 where X is oxygen atom

[Claim 8]

In above-mentioned General Chemical Formula 1, inside T, U and V, the one being CR⁴ basis, other one being CH group, in addition, remaining one being CR⁵ basis, acrylic acid derivative, which is stated in any of Claim 1 ~7 where W is CR⁴⁴ basis

[Claim 9]

horticultural microbicide, which designates that it contains acrylic acid derivative which is stated in any of Claim 1 ~8 as active ingredient as feature

[Description of the Invention]

[0001]

[Technological Field of Invention]

this invention regards acrylic acid derivative and its application.

[0002]

[Problems to be Solved by the Invention]

this invention designates that compound which possesses horticultural sterilization effectiveness which is superior is offered as problem.

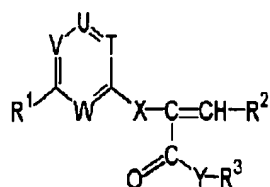
[0003]

[Means to Solve the Problems]

these inventors result of diligent investigation, discovered fact that it possesses horticultural sterilization effectiveness where acrylic acid derivative which is shown with postscript General Chemical Formula 2 is superior reached to this invention.

Namely, as for this invention, General Chemical Formula 2

[Chemical Formula 2]



[式中、 R^1 は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルケニルアルキル基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいアリールアルキル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよいヘテロアリールアルキル基、 A^1-L^1 -基、 $A^1-ON=CA^2$ -基、 $A^1SC(A^2)=N$ -基または $A^1SC(SA^2)=N$ -基(ここで、 L^1 は酸素原子、硫黄原子、NH基、またはアルキルイミノ基を表わし、 A^1 及び A^2 は同一または相異なり、置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルケニルアルキル基、置換されていてもよいアリール基、置換されていてもよいアリールアルキル基、置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールアルキル基を表わす。)を表わし、 R^2 は塩素原子または臭素原子を表わし、 R^3 は置換されていてもよいアルキル基を表わし、T、U及びVの内、一つは CR^4 基を表わし、他の一つはCH基または窒素原子を表わし、また、残りの一つは CR^5 基または窒素原子を表わし、Wは CR^{44} 基または窒素原子を表わす。 R^4 、 R^5 及び R^{44} は同一または相異なり、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基、ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、アルコキシカルボニル基、アルキルチオ基またはハロアルキルチオ基を表し、Xは NR^6 基、酸素原子または硫黄原子を表し、 R^6 は置換されていてもよいアルキル基を表す。但しXが硫黄原子である場合、 R^1 基はアルキル基ではない。Yは酸素原子を表わす。]

で示されるアクリル酸誘導体(以下、本発明化合物と記す。)及びそれを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤を提供する。

{In Formula, $R^{¹}$ optionally substitutable alkyl group, optionally substitutable alkenyl group, optionally substitutable alkynyl group, optionally substitutable cycloalkyl group, optionally substitutable cycloalkyl alkyl group, optionally substitutable cycloalkenyl group, optionally substitutable cycloalkenyl alkyl group, optionally substitutable aryl group, optionally substitutable arylalkyl basis, optionally substitutable heteroaryl group, optionally substitutable heteroaryl alkyl group, $A^{¹-L^{¹-}$ basis and $A^{¹-ON=CA^{²-}$ basis, the $A^{¹SC(A^{²)}=N$ - basis or $A^{¹SC(SA^{²)}=N$ - to display basic {Here, $L^{¹}$ displays oxygen atom, sulfur atom, NH group, or alkyl imino group, $A^{¹}$ and the $A^{²}$ identical or different, optionally substitutable alkyl group, optionally substitutable alkenyl group, optionally substitutable alkynyl group, optionally substitutable cycloalkyl group, optionally substitutable cycloalkyl alkyl group, optionally substitutable cycloalkenyl group, optionally substitutable cycloalkenyl alkyl group, optionally substitutable aryl group, optionally substitutable arylalkyl basis, display optionally substitutable heteroaryl group or optionally substitutable heteroaryl alkyl group. }, $R^{²}$ to display chlorine atom or bromine atom, $R^{³}$ to display optionally substitutable alkyl group, inside T, U and V, one to display $CR^{⁴}$ basis, other one to display CH group or nitrogen atom, in addition, Remaining one displays $CR^{⁵}$ basis or nitrogen atom, W displays $CR^{⁴⁴}$ basis or nitrogen atom. $R^{⁴}$, $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$ display identical or different, hydrogen atom, halogen atom, alkyl group, alkoxy group, haloalkyl group, haloalkoxy group, cyano group, nitro group, alkoxy carbonyl group, alkyl thio group or haloalkyl thio group, $XNR^{⁶}$ basis, displays oxygen atom or sulfur atom, $R^{⁶}$ displays optionally substitutable alkyl group. However when X is sulfur atom, $R^{¹}$ basis is not alkyl group. Y displays oxygen atom. }

So acrylic acid derivative which is shown (Below, the compound of this invention you inscribe.) and horticultural microbicide which contains that as active ingredient is offered.

【0004】

【発明の実施の形態】

本発明において、

R¹、A¹ 及び A² で示される置換されていてもよいアルキル基におけるアルキル基としては、

例えばメチル基、

エチル基、

プロピル基、

イソプロピル基、

ブチル基、

イソブチル基、

1-メチルプロピル基、

ペンチル基、

1-メチルブチル基、

1-エチルブチル基、

2-メチルブチル基、

3-メチルブチル基、

2,2-ジメチルプロピル基、

1,2-ジメチルプロピル基、

1,1-ジメチルプロピル基、

ヘキシル基、

1-メチルペンチル基、

1-エチルペンチル基、

3,3-ジメチルブチル基、

ヘプチル基、

3,7-ジメチルオクチル基等の C1~C10 アルキル基等があげられ、

R¹、A¹ 及び A² で示される置換されていてもよいアルケニル基におけるアルケニル基としては、

例えばビニル基、

アリル基、

1-メチル-2-プロペニル基、

2-メチル-2-プロペニル基、

2-ブテニル基、

[0004]

[Embodiment of the Invention]

Regarding to this invention,

R^¹,As alkyl group in optionally substitutable alkyl group which is shown with A^¹ and A^²,

for example methyl group ,

ethyl group ,

propyl group ,

isopropyl group ,

butyl group ,

isobutyl group ,

1 -methyl propyl group ,

pentyl group ,

1 -methyl butyl group ,

1 -ethyl butyl group ,

2 -methyl butyl group ,

3 -methyl butyl group ,

2 and 2 -dimethyl propyl group ,

1 and 2 -dimethyl propyl group ,

1 and 1 -dimethyl propyl group ,

hexyl group ,

1 -methyl pentyl group ,

1 -ethyl pentyl group ,

3 and 3 -dimethylbutyl group ,

heptyl group ,

Listing 3 and 7 -dimethyl octyl group or other C1~C10alkyl group etc,

R^¹,As alkenyl group in optionally substitutable alkenyl group which is shown with A^¹ and A^²,

for example vinyl group ,

allyl group ,

1 -methyl -2- propenyl group ,

2 -methyl -2- propenyl group ,

2 -butenyl group ,

2-ペンテニル基、

3-メチル-2-ブテニル基、

ゲラニル基等の C2~C10 アルケニル基等があげられ、

R¹、

A¹ 及び A² で示される置換されていてもよいアルキニル基におけるアルキニル基としては、

例えばエチニル基、

プロパルギル基、

1-メチル-2-プロピニル基、

3-メチル-2-プロピニル基等の C2~C10 アルキニル基等があげられ、

R¹、

A¹ 及び A² で示される置換されていてもよいシクロアルキル基におけるシクロアルキル基としては、

例えばシクロプロピル基、

シクロペンチル基、

シクロヘキシル基等の C3~C10 シクロアルキル基等があげられ、

R¹、

A¹ 及び A² で示される置換されていてもよいシクロアルキルアルキル基におけるシクロアルキルアルキル基としては、

例えばシクロプロピルメチル基、

シクロペンチルメチル基、

2-シクロペンチルエチル基、

シクロヘキシルメチル基等の C4~C20 シクロアルキルアルキル基等があげられ、

R¹、A¹ 及び A² で示される置換されていてもよいシクロアルケニル基におけるシクロアルケニル基としては、例えばシクロペンテニル基、シクロヘキセニル基等の C5~C10 シクロアルケニル基等があげられ、R¹、A¹ 及び A² で示される置換されていてもよいシクロアルケニルアルキル基におけるシクロアルケニルアルキル基としては、例えばシクロペンテン-1-イルメチル基、シクロヘキセン-1-イルメチル基等の C6~C20 シクロアルケニルアルキル基等があげられ、R¹、A¹ 及び A² で示される置換されていてもよいアリール基におけるアリール基としては、フェニル基、 α -ナフチル基、 β -ナフチル基等の C6~C10 のアリール基等があげられ、R¹、A¹ 及び A² で示される置換され

2-pentenyl group ,

3-methyl -2- butenyl group ,

Listing geranyl group or other C2~C10alkenyl group etc,

R^¹,

As alkynyl group in optionally substitutable alkynyl group which is shown with A^¹ and A^²,

for example ethynyl group ,

propargyl group ,

1 -methyl -2- propinyl group ,

Listing 3 -methyl -2- propinyl group or other C2~C10alkynyl group etc,

R^¹,

As cycloalkyl group in optionally substitutable cycloalkyl group which is shown with A^¹ and A^²,

for example cyclopropyl group ,

cyclopentyl group ,

Listing cyclohexyl group or other C3~C10cycloalkyl group etc,

R^¹,

As cycloalkyl alkyl group in optionally substitutable cycloalkyl alkyl group which is shown with A^¹ and A^²,

for example cyclopropyl methyl group ,

cyclopentyl methyl group ,

2 -cyclopentyl ethyl group ,

Listing cyclohexyl methyl group or other C4~C20cycloalkyl alkyl group etc,

You can list for example cyclopentenyl group , cyclohexenyl group or other C5~C10cycloalkenyl group etc as cycloalkenyl group in optionally substitutable cycloalkenyl group being shown with R^¹, A^¹ and A^², as aryl group in optionally substitutable aryl group to which for example cyclobutene -1- yl methyl group , cyclohexene -1- yl methyl group or other C6~C20cycloalkenyl alkyl group etc is listed as cycloalkenyl alkyl group in optionally substitutable cycloalkenyl alkyl group which is shown with R^¹, A^¹ and A^², is shown with R^¹, A^¹ and A^², phenyl group , α -naphthyl group , β -naphthyl group or other C6~C10 you can list aryl group etc, as the heteroaryl group in

ていてもよいアリールアルキル基におけるアリールアルキル基としては、例えばフェニルメチル基、2-フェニルエチル基、3-フェニル-n-プロピル基、4-フェニル-n-ブチル基、 α -ナフチルメチル基、 β -ナフチルメチル基等の C7~C20 アリールアルキル基等があげられ、 R^1 、 A^1 及び A^2 で示される置換されていてもよいヘテロアリール基におけるヘテロアリール基としては、例えば 2-ピリジル基、4-ピリジル基、2-ピリミジニル基、4-ピリミジニル基、3-ピラゾリル基、2-チアゾリル基、2-イミダゾリル基、3-(1,2,4-トリアゾリル)基、2-キノリル基等の C1~C9 ヘテロアリール基があげられ、 R^1 、 A^1 及び A^2 で示される置換されていてもよいヘテロアリールアルキル基におけるヘテロアリールアルキル基としては、例えば 2-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、2-ピリミジニルメチル基、4-ピリミジニルメチル基、3-ピラゾリルメチル基、2-チアゾリルメチル基、2-イミダゾリルメチル基、3-(1,2,4-トリアゾリル)メチル基、2-キノリルメチル基等の C2~C19 ヘテロアリールアルキル基があげられ、

【0005】

R^1 、

A^1 及び A^2 で示される、

置換されていてもよいアルキル基、

置換されていてもよいアルケニル基、

置換されていてもよいアルキニル基、

置換されていてもよいシクロアルキル基、

置換されていてもよいシクロアルキルアルキル基、

置換されていてもよいシクロアルケニル基、

置換されていてもよいシクロアルケニルアルキル基、

置換されていてもよいアリール基、

置換されていてもよいアリールアルキル基、

置換されていてもよいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロアリールアルキル基における置換基としては、

例えば、

ハロゲン原子〔塩素原子、臭素原子、フッ素原子等〕、

アルキル基〔例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、1-メチルプロピル基、ペンチル基、1-メチルブチル基、1-エチルブチル基、2-メチルブチル

optionally substitutable heteroaryl group to which for example phenylmethyl group, 2-phenylethyl group, 3-phenyl-n-propyl group, 4-phenyl-n-butyl group, α -naphthyl methyl group, the β -naphthyl methyl group or other C7~C20 arylalkyl basis etc is listed as arylalkyl basis in optionally substitutable arylalkyl basis which is shown with $R^{¹}$, $A^{¹}$ and $A^{²}$, is shown with $R^{¹}$, $A^{¹}$ and $A^{²}$, for example 2-pyridyl group, 4-pyridyl group, 2-pyrimidinyl group, 4-pyrimidinyl group, 3-pyrazolyl group, 2-thiazolyl group, 2-imidazolyl group, 3-(1, 2 and 4-triazolyl) basis, increasing 2-quinolinyl group or other C1~C9 heteroaryl group, As heteroaryl alkyl group in optionally substitutable heteroaryl alkyl group which is shown with $R^{¹}$, $A^{¹}$ and $A^{²}$, increasing for example 2-pyridyl methyl group, 4-pyridyl methyl group, 2-pyrimidinyl methyl group, 4-pyrimidinyl methyl group, 3-pyrazolyl methyl group, 2-thiazolyl methyl group, 2-imidazolyl methyl group, 3-(1, 2 and 4-triazolyl) methyl group, 2-quinolinyl methyl group or other C2~C19 heteroaryl alkyl group,

【0005】

$R^{¹}$,

It is shown with $A^{¹}$ and $A^{²}$,

optionally substitutable alkyl group,

optionally substitutable alkenyl group,

optionally substitutable alkynyl group,

optionally substitutable cycloalkyl group,

optionally substitutable cycloalkyl alkyl group,

optionally substitutable cycloalkenyl group,

optionally substitutable cycloalkenyl alkyl group,

optionally substitutable aryl group,

optionally substitutable arylalkyl basis,

As substituent in optionally substitutable heteroaryl group or optionally substitutable heteroaryl alkyl group,

for example

halogen atom {chlorine atom, bromine atom, fluorine atom etc},

alkyl group {for example methyl group, ethyl group, propyl group, isopropyl group, butyl group, isobutyl group, 1-methyl propyl group, pentyl group, 1-methyl butyl group, 1-ethyl butyl group, 2-methyl butyl group, 3-methyl butyl

基、3-メチルブチル基、2,2-ジメチルプロピル基、1,2-ジメチルプロピル基、1,1-ジメチルプロピル基、ヘキシル基、1-メチルペンチル基、1-エチルペンチル基、3,3-ジメチルブチル基、ヘブチル基、3,7-ジメチルオクチル基等の C1~C10 アルキル基等]、

ハロアルキル基[例えばトリフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、1,1,2,2-テトラフルオロエチル基等の C1~C10 ハロアルキル基等]、

シクロアルキル基[例えばシクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の C3~C10 シクロアルキル基]、

アルコキシ基[例えばメトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、i-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基等の C1~C10 アルコキシ基]、

ハロアルコキシ基[例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、ジフルオロプロモメトキシ基、ジフルオロクロメトキシ基、フルオロメトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ基等の C1~C10 ハロアルコキシ基]、

アルキルチオ基[例えばメチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、i-ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基等の C1~C10 アルキルチオ基]、

ハロアルキルチオ基[例えばトリフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、ジフルオロプロモメチルチオ基、ジフルオロクロメチルチオ基、フルオロメチルチオ基、2,2,2-トリフルオロエチルチオ基、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ基等の C1~C10 ハロアルキルチオ基]、アルキルアミノ基[例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、i-プロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、sec-ブチルアミノ基、i-ブチルアミノ基、n-ペンチルアミノ基等の C1~C10 アルキルアミノ基]、ジアルキルアミノ基[例えばジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、エチル-n-プロピルアミノ基等の C2~C20 ジアルキルアミノ基]、アルコキシカルボニル基[メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、i-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、n-ペンチルオキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基等の C2~C10 アルコキシカルボニル基]、ハロアルコキシカルボニル基[例えば 2,2,2-トリフルオロエトキシカルボニル基等の C2~C10 ハロアルコキシカルボニル基]、アルキルアミノカ

group, 2, 2- dimethyl propyl group, 1, 2- dimethyl propyl group, 1, 1- dimethyl propyl group, hexyl group, 1- methyl pentyl group, 1- ethyl pentyl group, 3, 3- dimethylbutyl group, heptyl group, 3, 7-dimethyl octyl group or other C1~C10alkyl group etc},

haloalkyl group {for example trifluoromethyl group, 2, 2, 2-trifluoroethyl basis, 1, 1, 2 and 2 -tetrafluoroethyl group or other C1~C10haloalkyl group etc},

cycloalkyl group {for example cyclopropyl group, cyclopentyl group, cyclohexyl group or other C3~C10cycloalkyl group },

alkoxy group {for example methoxy group, ethoxy group, n-propoxy group, i- propoxy group, n- butoxy group, s -butoxy group, i- butoxy group, n- pentyloxy group or other C1~C10alkoxy group },

haloalkoxy group {for example trifluoromethoxy group, difluoro methoxy group, difluoro bromo methoxy group, difluoro chloro methoxy group, fluoro methoxy group, 2, 2, 2- trifluoro ethoxy group, 1, 1, 2, 2- tetrafluoro ethoxy group or other C1~C10haloalkoxy group },

alkyl thio group {for example methylthio group, ethyl thio group, n- propyl thio group, n- butyl thio group, i- butyl thio group, s-butyl thio group, n- pentyl thio group, n- hexylthio group or other C1~C10alkyl thio group },

haloalkyl thio group {for example trifluoromethyl thio group, difluoromethyl thio group, difluoro bromomethyl thio group, difluoro chloromethyl thio group, fluoromethyl thio group, 2, 2, 2- trifluoroethyl thio group, 1, 1, 2, 2- tetrafluoroethyl thio group or other C1~C10haloalkyl thio group }, alkyl amino group {for example methylamino group, ethylamino group, n- propyl amino group, i-propyl amino group, n- butyl amino group, s-butyl amino group, i- butyl amino group, n- pentyl amino group or other C1~C10alkyl amino group }, dialkyl amino group {for example dimethylamino group, diethyl amino group, methylethyl amino group, ethyl -n- propyl amino group or other C2~C20dialkyl amino group }, alkoxy carbonyl group {methoxycarbonyl group, ethoxy carbonyl group, n- propoxy carbonyl group, i- propoxy carbonyl group, n- butoxy carbonyl group, i- butoxy carbonyl group, s -butoxy carbonyl group, n- pentyloxy carbonyl group, n- hexyloxy carbonyl group or other C2~C10alkoxy carbonyl group }, haloalkoxy carbonyl group {for example 2, 2, 2- trifluoro ethoxy carbonyl group or other C2~C10haloalkoxy carbonyl group }, alkyl amino carbonyl group {for example methylamino carbonyl group, ethylamino carbonyl group, n- propyl amino carbonyl group, i-propyl amino carbonyl group, n- butyl amino carbonyl group, i-

ルボニル基〔例えばメチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、n-プロピルアミノカルボニル基、i-プロピルアミノカルボニル基、n-ブチルアミノカルボニル基、i-ブチルアミノカルボニル基、sec-ブチルアミノカルボニル基、n-ペンチルアミノカルボニル基、n-ヘキシルアミノカルボニル基等の C2~C10 アルキルアミノカルボニル基〕、ジアルキルアミノカルボニル基〔例えばジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、メチルエチルアミノカルボニル基、エチル-n-プロピルアミノカルボニル基等の C3~C10 ジアルキルアミノカルボニル基〕、アシルアミノ基〔例えばアセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、n-ブタノイルアミノ基等の C2~C10 アシルアミノ基〕、アルコキシカルボニルアミノ基〔例えばメトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、n-プロポキシカルボニルアミノ基、i-プロポキシカルボニルアミノ基、n-ブトキシカルボニルアミノ基等の C2~C10 アルコキシカルボニルアミノ基〕、シアノ基及びニトロ基等があげられ、

【0006】

R³ で示される置換されていてもよいアルキル基としては例えばメチル基、

エチル基等の C1~C5 アルキル基があげられ、

R⁴、

R⁵ 及び R⁴⁴ で示されるハロゲン原子としては例えば塩素原子、

臭素原子、

フッ素原子等があげられ、

R⁴、

R⁵ 及び R⁴⁴ で示されるアルキル基としては、

例えばメチル基、

エチル基、

プロピル基、

イソプロピル基、

ブチル基、

イソブチル基、

1-メチルプロピル基、

ペンチル基、

1-メチルブチル基、

1-エチルブチル基、

butyl amino carbonyl group , s-butyl amino carbonyl group , n- pentyl amino carbonyl group , n- hexyl amino carbonyl group or other C2~C10alkyl amino carbonyl group }, dialkyl amino carbonyl group {for example dimethylamino carbonyl group , diethyl amino carbonyl group , methylethyl amino carbonyl group , ethyl -n- propyl amino carbonyl group or other C3~C10dialkyl amino carbonyl group }, acyl amino group {for example acetylamino group , propanoyl amino group , n- butanoyl amino group or other C2~C10acyl amino group }, alkoxy carbonyl amino group {for example methoxycarbonylamino basis, ethoxy carbonyl amino group , n- propoxy carbonyl amino group , i- propoxy carbonyl amino group , n- butoxy carbonyl amino group or other C2~C10alkoxy carbonyl amino group }, listing cyano group and nitro group etc,

【0006】

As optionally substitutable alkyl group which is shown with R³ for example methyl group ,

Increasing ethyl group or other C1~C5alkyl group ,

R⁴,

As halogen atom which is shown with R⁵ and R⁴⁴ for example chlorine atom ,

bromine atom ,

Listing fluorine atom etc,

R⁴,

As alkyl group which is shown with R⁵ and R⁴⁴,

for example methyl group ,

ethyl group ,

propyl group ,

isopropyl group ,

butyl group ,

isobutyl group ,

1 -methyl propyl group ,

pentyl group ,

1 -methyl butyl group ,

1 -ethyl butyl group ,

2-メチルブチル基、
 3-メチルブチル基、
 2,2-ジメチルプロピル基、
 1,2-ジメチルプロピル基、
 1,1-ジメチルプロピル基、
 ヘキシル基、
 1-メチルペンチル基、
 1-エチルペンチル基、
 3,3-ジメチルブチル基、
 ヘブチル基、
 3,7-ジメチルオクチル基等の C1~C10 アルキル基があげられ、
 R^4 、

R^5 及び R^{44} で示されるアルコキシ基としては例えばメトキシ基、

エトキシ基、n-プロポキシ基、i-プロポキシ基、n-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、i-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基等の C1~C10 アルコキシ基があげられ、 R^4 、 R^5 及び R^{44} で示されるハロアルキル基としては例えばトリフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、1,1,2,2-テトラフルオロエチル基等の C1~C10 ハロアルキル基等があげられ、 R^4 、 R^5 及び R^{44} で示されるハロアルコキシ基としては例えばトリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、ジフルオロプロモメトキシ基、ジフルオロクロメトキシ基、フルオロメトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ基等の C1~C10 ハロアルコキシ基があげられ、 R^4 、 R^5 及び R^{44} で示されるアルコキシカルボニル基としては例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、i-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、n-ペンチルオキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基等の C2~C10 アルコキシカルボニル基があげられ、 R^4 、 R^5 及び R^{44} で示されるアルキルチオ基としては例えばメチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、i-ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基等の C1~C10 アルキルチオ基があげられ、 R^4 、 R^5 及び R^{44} で示されるハロアルキルチオ基としては例えばトリフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、ジフルオロプロモメチルチオ基、ジフルオロクロメチルチオ基、フルオロメチルチオ基、2,2,2-トリフルオロエチルチオ

2-methyl butyl group ,
 3-methyl butyl group ,
 2 and 2 -dimethyl propyl group ,
 1 and 2 -dimethyl propyl group ,
 1 and 1 -dimethyl propyl group ,
 hexyl group ,
 1-methyl pentyl group ,
 1-ethyl pentyl group ,
 3 and 3 -dimethylbutyl group ,
 heptyl group ,
 Increasing 3 and 7 -dimethyl octyl group or other C1~C10alkyl group ,
 $R^{⁴}$,

As alkoxy group which is shown with $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$ for example methoxy group ,

It can increase ethoxy group , n- propoxy group , i- propoxy group , n- butoxy group , s -butoxy group , i- butoxy group , n- pentyloxy group or other C1~C10alkoxy group , for example trifluoromethyl group , 2, 2, 2- trifluoroethyl basis, it can list 1, 1, 2 and 2-tetrafluoroethyl group or other C1~C10haloalkyl group etc as haloalkyl group which is shown with $R^{⁴}$, $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$, as alkoxy carbonyl group where for example trifluoromethoxy group , difluoro methoxy group , difluoro bromo methoxy group , difluoro chloro methoxy group , fluoro methoxy group , 2, 2, 2- trifluoro ethoxy group , 1, 1, 2, 2- tetrafluoro ethoxy group or other C1~C10haloalkoxy group is lifted as haloalkoxy group which is shown with $R^{⁴}$, $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$, is shown with $R^{⁴}$, $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$ increasing for example methoxycarbonyl group , ethoxy carbonyl group , n- propoxy carbonyl group , i- propoxy carbonyl group , n- butoxy carbonyl group , i- butoxy carbonyl group , s -butoxy carbonyl group , n- pentyloxy carbonyl group , n- hexyloxy carbonyl group or other C2~C10alkoxy carbonyl group , It can increase for example methylthio group , ethyl thio group , n- propyl thio group , n- butyl thio group , i- butyl thio group , s-butyl thio group , n- pentyl thio group , n- hexylthio group or other C1~C10alkyl thio group as alkyl thio group which is shown with $R^{⁴}$, $R^{⁵}$ and $R^{⁴⁴}$, it can increase for example trifluoromethyl thio group , difluoromethyl thio group , difluoro bromomethyl thio group , difluoro chloromethyl thio group , fluoromethyl thio group , 2, 2, 2- trifluoroethyl thio group , 1, 1, 2, 2- tetrafluoroethyl thio group or other C1~C10haloalkyl thio

基、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ基等の C1~C10 ハロアルキルチオ基があげられ、R⁶ で示される置換されていてもよいアルキル基としては例えばメチル基、エチル基等の C1~C10 アルキル基があげられる。

T、U、V 及び W を含む 6 員環状芳香族環の具体例としてはベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環等があげられる。

【0007】

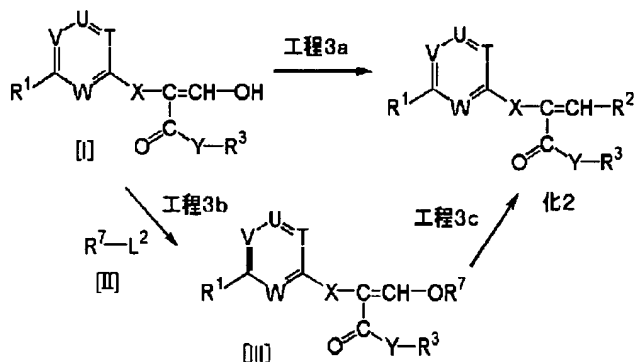
本発明化合物には C=N 結合及び/または C=C 結合に基づく(E)、(Z)の異性体が存在するが、その各々及びその混合物が本発明に含まれる。

(ここで用いた(E)及び(Z)という用語は、広く幾何異性体を示すのに使用されているカーン-インゴールド-プレローグ則により定義されるものである。)

【0008】

本発明化合物は例えば、下記スキーム 化 3 またはスキーム 化 4 で示される合成スキームにしたがって製造することが出来る。

【化 3】



[式中、R¹、R²、R³、T、U、V、W、X 及び Y は前記と同じ意味を表わし、R⁷ は例えば p-トルエンスルフォニル基、メタンスルフォニル基、トリフルオロメタンスルフォニル基等を表わし、L² は例えば塩素原子、臭素原子、フッ素原子等のハロゲン原子または p-トルエンスルフォニルオキシ基、メタンスルフォニルオキシ基、トリフルオロメタンスルフォニルオキシ基等の脱離基を表わす。]

【0009】

工程 3a は化合物 [1] をハロゲン化試剤でハロゲ

group as haloalkyl thio group which is shown with R^⁴

, R^{⁵ and R^{⁴⁴}, it can increase for example methyl group , ethyl group or other C1~C10alkyl group as optionally substitutable alkyl group which is shown with R^⁶.}

benzene ring , pyridine ring , pyrimidine ring etc it is listed T, U, V and 6 -member ring aromatic ring where W is included as embodiment .

【0007】

It is based on C=N connection and/or C=C connection in the compound of this invention , (E) , the isomer of (Z) can exist, but each and its mixture is included in this invention .

(It used here, (E) and (Z) with term which is said, although the enantiomer is shown widely, is something which is defined Cahn -Ingold - which is used by [pureroogu] rule.)

【0008】

Following to synthesis scheme which is shown with for example below-mentioned scheme Chemical Formula 3 or scheme Chemical Formula 4 , to produce it is possible the compound of this invention .

[Chemical Formula 3]

{In Formula, R^¹, R^², R^³, T, U, V, W, X and Y displays same meaning as description above, R^⁷ displays for example p-toluene sulfonyl group , methane sulfonyl group , trifluoromethane sulfonyl group etc, L^² displays for example chlorine atom , bromine atom , fluorine atom or other halogen atom or p- toluene sulfonyl oxy group , methane sulfonyl oxy group , trifluoromethane sulfonyl oxy group or other leaving group . }

【0009】

To do compound [1] by halogenation doing with halogenation

ン化することにより行うことができる。

該反応の反応温度は通常-80~200 deg C の範囲であり、反応時間は通常1~100時間の範囲である。

反応に供される試剤の量は、化合物[1]1 モルに対してハロゲン化試剤は1~100モルの割合である。

該反応に用いられるハロゲン化試剤としては例えば、オギザリルクロリド、塩化チオニル、臭化チオニル、四塩化炭素-トリフェニルフォスフィン混合物、四臭化炭素-トリフェニルフォスフィン混合物等があげられる。

該反応は必要に応じて溶媒を用い、かかる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロホルム、ジクロロエタン、四塩化炭素、モノクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ニトロエタン、ニトロベンゼン等のニトロ化合物類、アセトニトリル、イソブチロニトリル等のニトリル類等あるいはそれらの混合物があげられる。

反応終了後の反応液は有機溶媒抽出、濃縮等の後処理操作を行い、必要ならば再結晶、クロマトグラフィ等により更に精製して、目的化合物を単離することができる。

【0010】

工程 3b は化合物[1]とスルホン酸誘導体[II]とを溶媒中、塩基の存在下に反応させることにより行うことができる。

該反応の反応温度は通常-80~100 deg C の範囲であり、反応時間は通常1~100時間の範囲である。

反応に供される試剤の量は、化合物[1]1 モルに対してスルホン酸誘導体[II]は1~5モルの割合、塩基は1~10モルの割合である。

スルホン酸誘導体[II]としては例えば p-トルエンスルフォニルクロリド、メタンスルフォニルクロリド、トリフルオロメタンスルフォニルクロリド、トリフルオロメタンスルフォニルフルオリド、メタンスルホン酸無水物またはトリフルオロメタンスルホン酸無水物等のスルホン酸誘導体があげられる。

塩基としては例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウム、水酸化カルシウム、

reagent it is possible step 3a.

As for reaction temperature of said reaction of usually - in range 80 - 200 deg C, as for reaction time it is a range of usually 1 - 100 hours.

As for quantity of reagent which is offered to reaction, as for halogenation reagent it is a ratio of 1 - 100 mole compound [1] vis-a-vis 1 mole .

You can list for example oxalyl chloride , thionyl chloride , thionyl bromide , carbon tetrachloride -triphenyl phosphine mixture , carbon tetrabromide -triphenyl phosphine mixture etc as halogenation reagent which is used for said reaction.

As for said reaction for example 1, 4- dioxane , tetrahydrofuran , ethyleneglycol dimethyl ether , diethylene glycol dimethyl ether , t- butyl methyl ether or other ethers , hexane , heptane , ligroin , petroleum ether or other aliphatic hydrocarbons , toluene , xylene or other aromatic hydrocarbons , chloroform , dichloroethane , carbon tetrachloride , monochloro benzene or other halogenated hydrocarbons , nitroethane , nitrobenzene or other nitro compound and acetonitrile , isobutyronitrile or other nitriles etc or it can increase mixture of those making use of according to need solvent , as this solvent .

If reaction mixture after reaction termination does organic solvent extraction , concentrated or other post-treatment and it is necessary, furthermore refining with recrystallization , chromatography etc, it can isolate target compound .

[0010]

step 3b compound [1] with can do sulfonic acid derivative [II] by reacting in the solvent and under existing of base .

As for reaction temperature of said reaction of usually - in range 80 - 100 deg C, as for reaction time it is a range of usually 1 - 100 hours.

As for quantity of reagent which is offered to reaction, as for sulfonic acid derivative [II] ratio of 1 - 5 mole , as for base it is a ratio of 1- 10 mole compound [1] vis-a-vis 1 mole .

It can increase for example p- toluene sulfonyl chloride , methane sulfonyl chloride , trifluoromethane sulfonyl chloride , trifluoromethane sulfonyl fluoride , methane sulfonic acid anhydride or trifluoromethanesulfonic acid anhydride or other sulfonic acid derivative sulfonic acid derivative [II] as.

for example sodium hydroxide , potassium hydroxide , barium hydroxide , calcium hydroxide , sodium carbonate , potassium

炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸バリウム、炭酸カルシウム等の無機塩基類、ピリジン、2-ピコリン、4-ピコリン、4-ジメチルアミノピリジン、キノリン、トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン等の有機塩基類、あるいは、これらの混合物があげられる。

該塩基は、例えば、塩酸、硫酸等の鉱酸類、酢酸、安息香酸等のカルボン酸類、塩化亜鉛等のルイス酸類等と塩を形成していてもよく、たとえば、酢酸ナトリウム等があげられる。

溶媒としては、例えば 1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロホルム、ジクロロエタン、四塩化炭素、モノクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ピリジン、トリエチルアミン、N-メチルアニリン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン等の有機塩基類、蟻酸エチル、酢酸ブチル、酢酸エチル、炭酸ジエチル等のエステル類、ニトロエタン、ニトロベンゼン等のニトロ化合物類、アセトニトリル、イソブチロニトリル等のニトリル類、水等あるいはそれらの混合物があげられる。

反応終了後の反応液は有機溶媒抽出、濃縮等の後処理操作を行い、必要ならば再結晶、クロマトグラフィ等により更に精製して、目的化合物を単離することができる。

【0011】

工程 3c は化合物 [III] を溶媒中、ハロゲン化試剤でハロゲン化することにより行うことができる。

該反応の反応温度は通常 -80~200 deg C の範囲であり、反応時間は 1~100 時間の範囲である。

反応に供される試剤の量は、化合物 [III] 1 モルに対してハロゲン化試剤は 1~100 モルの割合である。

ハロゲン化試剤としては例えばベンジルトリエチルアンモニウムクロリド、ベンジルトリエチルアンモニウムブロミド等の 4 級アンモニウム塩類、臭化リチウム、塩化リチウム、臭化ナトリウム、塩化ナトリウム、臭化カリウム、塩化カリウム、臭化セシウム、塩化セシウム等の金属ハロゲン化物塩類等があげられる。

carbonate, barium carbonate, calcium carbonate or other inorganic base and pyridine, 2- picoline, 4- picoline, 4- dimethylamino pyridine, quinoline, triethylamine, ethyl diisopropyl amine, N, N- dimethyl aniline, N, N- diethylaniline or other organic bases, or, it can increase these mixture as base.

said base, for example hydrochloric acid, sulfuric acid or other mineral acid, acetic acid, benzoic acid or other carboxylic acid and zinc chloride or other Lewis acid etc and may form salt, the for example sodium acetate etc can list.

As solvent, for example 1, 4- dioxane, tetrahydrofuran, ethyleneglycol dimethyl ether, diethylene glycol dimethyl ether, t- butyl methyl ether or other ethers, hexane, heptane, ligroin, petroleum ether or other aliphatic hydrocarbons, toluene, xylene or other aromatic hydrocarbons, chloroform, dichloroethane, carbon tetrachloride, monochloro benzene or other halogenated hydrocarbons, pyridine, triethylamine, N- methylaniline, N, N- dimethyl aniline, N, N- diethylaniline or other organic bases, ethyl formate, butyl acetate, ethylacetate, diethyl carbonate or other esters, nitroethane, nitrobenzene or other nitro compound and acetonitrile, isobutyronitrile or other nitriles, water etc or it can increase the mixture of those.

If reaction mixture after reaction termination does organic solvent extraction, concentrated or other post-treatment and it is necessary, furthermore refining with recrystallization, chromatography etc, it can isolate target compound.

【0011】

To do compound [III] in solvent, by halogenation doing with halogenation reagent it is possible step 3c.

As for reaction temperature of said reaction of usually - in range 80 - 200 deg C, as for reaction time it is a range of 1 - 100 hours.

As for quantity of reagent which is offered to reaction, as for halogenation reagent it is a ratio of 1 - 100 mole compound [III] vis-a-vis 1 mole.

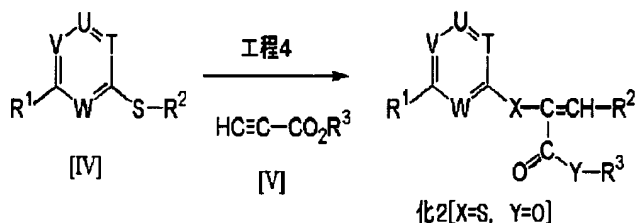
for example benzyl triethyl ammonium chloride, benzyl triethyl ammonium bromide or other quaternary ammonium salt and lithium bromide, lithium chloride, sodium bromide, sodium chloride, potassium bromide, potassium chloride, cesium bromide, cesium chloride or other metal halide salts etc are listed as halogenation reagent.

溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、イソプロパノール等のアルコール類、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素、モノクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ピリジン、トリエチルアミン、N-メチルアニリン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン等の有機塩基類、酢酸等の有機酸類、蟻酸エチル、酢酸ブチル、酢酸エチル、炭酸ジエチル等のエステル類、ニトロエタン、ニトロベンゼン等のニトロ化合物類、アセトニトリル、イソブチロニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチル-2-イミダゾリドン、スルホラン、水等あるいはそれらの混合物があげられる。

反応終了後の反応液は有機溶媒抽出、濃縮等の後処理操作を行い、必要ならば再結晶、クロマトグラフィ等により更に精製して、目的化合物を単離することができる。

【0012】

【化 4】



〔式中、R¹、R²、R³、T、U、V 及び W は前記と同じ意味を表す。〕

【0013】

工程 4 はスルフェニルハライド〔IV〕とプロピン酸エステルとを溶媒中、反応させることにより行うことができる。

該反応の反応温度は通常 0-200 deg C の範囲であり、反応時間は通常 1-100 時間の範囲である。

反応に供される試剤の量は、化合物〔IV〕1 モルに対してプロピン酸エステルは 1-10 モルの割合である。

As solvent , for example methanol , ethanol , propanol , butanol , isopropanol or other alcohols , 1, 4- dioxane , tetrahydrofuran , ethyleneglycol dimethyl ether , diethylene glycol dimethyl ether , t- butyl methyl ether or other ethers , hexane , heptane , ligroin , petroleum ether or other aliphatic hydrocarbons , toluene , xylene or other aromatic hydrocarbons , chloroform , dichloromethane , dichloroethane , carbon tetrachloride , monochloro benzene or other halogenated hydrocarbons , pyridine , triethylamine , N- methylaniline , N, N- dimethyl aniline , N, N- diethylaniline or other organic bases , acetic acid or other organic acids , ethyl formate , butyl acetate , ethylacetate , diethyl carbonate or other esters , nitroethane , nitrobenzene or other nitro compound and acetonitrile , isobutyronitrile or other nitriles , N, N- dimethylformamide , dimethyl sulfoxide , N, N- dimethyl -2- imidazolidone , sulfolane , water etc or it can increase the mixture of those .

If reaction mixture after reaction termination does organic solvent extraction , concentrated or other post-treatment and it is necessary, furthermore refining with recrystallization , chromatography etc, it can isolate target compound .

【0012】

【Chemical Formula 4】

{In Formula, R¹, R², R³, T, U, V and W display same meaning as description above. }

【0013】

step 4 sulfenyl halide [IV] with can do propynoic acid ester in solvent , by reacting.

As for reaction temperature of said reaction in range of usually 0 - 200 deg C, as for reaction time it is a range of usually 1 - 100 hours.

As for quantity of reagent which is offered to reaction, as for propynoic acid ester it is a ratio of 1 - 10 mole compound [IV] vis-a-vis 1 mole .

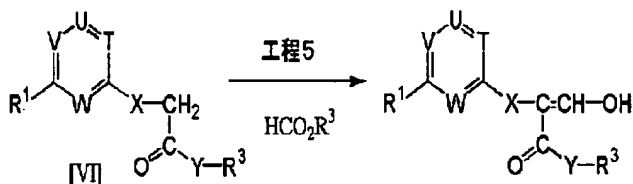
溶媒としては、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、イソプロパノール等のアルコール類、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロホルム、ジクロロエタン、四塩化炭素、モノクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸等の有機酸類、蟻酸エチル、酢酸ブチル、酢酸エチル、炭酸ジエチル等のエステル類、ニトロエタン、ニトロベンゼン等のニトロ化合物類等あるいはそれらの混合物があげられる。

反応終了後の反応液は有機溶媒抽出、濃縮等の後処理操作を行い、必要ならば再結晶、クロマトグラフィ等により更に精製して、目的化合物を単離することができる。

【0014】

前記スキーム 化3における化合物[1]は例えば下記のスキーム 化5に従って製造することができる。

【化5】



〔式中、R¹、R³、T、U、V、W 及び X は前記と同じ意味を表す。〕

【0015】

工程5は、化合物[VI]とギ酸エステル類とを溶媒中、塩基の存在下に反応させることにより行うことができる。

該反応の反応温度は通常 0~150 deg C の範囲であり、反応時間は通常 1~24 時間の範囲である。

反応に供される試剤の量は、化合物[VI]1 モルに対してギ酸エステル類は 1~100 モルの割合、塩基は 1~10 モルの割合である。

塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等の無機塩基類、ナトリウムメトキド、ナトリウムエトキド、カリウム-tert-ブトキド等のアルカリ金属アルコキシド類、マグネシウムエトキド等のアルカリ土類金属アルコキシド類、

As solvent, for example methanol, ethanol, propanol, butanol, isopropanol or other alcohols, 1,4-dioxane, tetrahydrofuran, ethyleneglycol dimethyl ether, diethylene glycol dimethyl ether, t-butyl methyl ether or other ethers, hexane, heptane, ligroin, petroleum ether or other aliphatic hydrocarbons, toluene, xylene or other aromatic hydrocarbons, chloroform, dichloroethane, carbon tetrachloride, monochloro benzene or other halogenated hydrocarbons, acetic acid or other organic acids, ethyl formate, butyl acetate, ethylacetate, diethyl carbonate or other esters, nitroethane, nitrobenzene or other nitro compound etc or it can increase mixture of those.

If reaction mixture after reaction termination does organic solvent extraction, concentrated or other post-treatment and it is necessary, furthermore refining with recrystallization, chromatography etc, it can isolate target compound.

【0014】

Following to for example below-mentioned scheme Chemical Formula 5, to produce it is possible compound [1] in aforementioned scheme Chemical Formula 3.

〔Chemical Formula 5〕

{In Formula, R¹, R³, T, U, V, W and X display same meaning as description above. }

【0015】

compound [VI] with to do formic acid esters by reacting in solvent and under existing of base it is possible step 5.

As for reaction temperature of said reaction in range of usually 0 - 150 deg C, as for reaction time it is a range of usually 1 - 24 hours.

As for quantity of reagent which is offered to reaction, as for formic acid esters ratio of 1 - 100 mole, as for base it is a ratio of 1 - 10 mole compound [VI] vis-a-vis 1 mole.

As base, for example sodium hydride, potassium hydride or other inorganic base, sodium methoxide, sodium ethoxide, potassium-t-butoxide or other alkali metal alkoxides, magnesium ethoxide or other alkaline earth metal alkoxides, sodium amide, lithium amide, lithium diisopropyl amide,

ナトリウムアミド、リチウムアミド、リチウムジソプロピルアミド、ナトリウムヘキサメチルジシラジド、リチウムヘキサメチルジシラジド等のアルカリ金属アミド類及びこれらの混合物があげられる。

溶媒としては例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、イソプロパノール等のアルコール類、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロエタン、四塩化炭素、モノクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ピリジン、トリエチルアミン、N-メチルアニリン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン等の有機塩基類、蟻酸エチル、酢酸ブチル、酢酸エチル、炭酸ジエチル等のエステル類、ニトロエタン、ニトロベンゼン等のニトロ化合物類、アセトニトリル、イソブチロニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチル-2-イミダゾリドン、スルホラン等あるいはそれらの混合物があげられる。

反応終了後の反応液は希塩酸などの酸性水溶液で処理した後、有機溶媒抽出、濃縮等の通常の後処理を行い、必要ならば再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製して、目的化合物を単離することができる。

前記スキーム 化 4 における化合物[IV]は例えば新実験化学講座 14 [III] 巻 1742~1746 頁 (1978 年丸善) に記載の方法に準じて製造することが出来る。

【0016】

本発明化合物を農園芸用殺菌剤の有効成分として用いる場合、他の何らの成分も加えずそのまま用いてもよいが、通常は固体担体、液体担体、界面活性剤、その他の製剤用補助剤と混合して、乳剤、水和剤、懸濁剤、粉剤、粒剤等に製剤して用いる。

これらの製剤には有効成分として本発明化合物を、重量比で通常、0.1~99.9%、好ましくは1~90%含有する。

かかる製剤化の際に用いられる、固体担体としては、例えばカオリンクレ-、アッタパルジャイトクレ-、ベントナイト、酸性白土、パイロフィライト、タ

sodium hexamethyl disilazide, lithium hexamethyl disilazide or other alkali metal amides and these mixture are lifted.

for example methanol, ethanol, propanol, butanol, isopropanol or other alcohols, 1, 4- dioxane, tetrahydrofuran, ethyleneglycol dimethyl ether, diethylene glycol dimethyl ether, t- butyl methyl ether or other ethers, hexane, heptane, ligroin, petroleum ether or other aliphatic hydrocarbons, toluene, xylene or other aromatic hydrocarbons, dichloroethane, carbon tetrachloride, monochloro benzene or other halogenated hydrocarbons, pyridine, triethylamine, N- methylaniline, N, N- dimethyl aniline, N, N- diethylaniline or other organic bases, ethyl formate, butyl acetate, ethylacetate, diethyl carbonate or other esters, nitroethane, nitrobenzene or other nitro compound and acetonitrile, isobutyronitrile or other nitriles, N, N- dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, N, N- dimethyl -2- imidazolidone, sulfolane etc or it can increase mixture of those as solvent .

If reaction mixture after reaction termination after treating with dilute hydrochloric acid or other acidic water solution, does the organic solvent extraction, concentrated or other conventional post-treatment and it is necessary, furthermore refining with recrystallization, chromatography etc, it can isolate target compound .

To produce according to method which is stated in for example New Lectures in Experimental Chemistry 14 [III]volumen 1742 - 1746 page (1978 Maruzen) it is possible compound [IV] in theaforementioned scheme Chemical Formula 4 .

【0016】

When the compound of this invention it uses, as active ingredient of horticultural microbicide it does not addeither component of other what and is possible to use that way, but usually auxiliary agent with for solid carrier, liquid carrier, boundary mixing surfactant, other formulation, formulation doing in emulsion, wettable, suspension, powder, granule etc, it uses.

In these formulation the compound of this invention, usually, 0.1 - 99.9%, preferably 1~90% is contained with weight ratio as active ingredient .

It is used, for example kaolin clay, attapulgite clay, bentonite (DANA 71.3.1a.1-2), acidic clay, pyrophyllite (DANA 71.2.1.1), talc, silicon algae earth, be able to list calcite,

ルク、珪藻土、方解石、トウモロコシ穂軸粉、クルミ殻粉、尿素、硫酸アンモニウム、合成含水酸化珪素等の微粉末あるいは粒状物等があげられ、液体担体としては、例えばキシレン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類、イソプロパノール、エチレングリコール、セロソルブ等のアルコール類、アセトン、シクロヘキサノン、イソホロン等のケトン類、ダイズ油、綿実油等の植物油、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル、水等があげられる。

界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキル(アリール)スルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテルリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物等の陰イオン界面活性剤、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤等があげられる。

製剤用補助剤としては、例えばリグニンスルホン酸塩、アルギン酸塩、ポリビニルアルコール、アラビアガム、CMC(カルボキシメチルセルロース)、PAP(酸性リン酸イソプロピル)等があげられる。

本発明化合物の施用方法としては、具体的には茎葉散布、土壌処理、種子消毒等があげられ、さらに、通常、当業者が利用するどのような施用方法にても用いることができる。

【0017】

本発明化合物を農園芸用殺菌剤の有効成分として用いる場合、その有効成分の施用量は、対象植物(作物等)の種類、対象病害の種類、病害の発生程度、製剤形態、施用方法、施用時期、気象条件等によって変化し得るが、1 アールあたり通常 0.01~50g、好ましくは 0.05~10g である。

乳剤、水和剤、懸濁剤等を水で希釈して施用する場合、その施用濃度は、0.0001~0.5%、好ましくは 0.0005~0.2% であり、粉剤、粒剤等はなんら希釈することなくそのまま施用する。

【0018】

本発明化合物は、畑地、水田、果樹園、茶園、牧草地、芝生地等の農園芸用殺菌剤として用いることができ、他の農園芸用殺菌剤と混合して用いることにより、殺菌効力の増強をも期待できる。

混合し得る他の農園芸用殺菌剤としては、たとえば、プロピコナゾール、トリアジメノール、プロクロ

corn cob powder, walnut shell flour, urea, ammonium sulfate, synthetic hydrated silicon oxide or other fine powder or granule etc as solid carrier, you can list for example xylene, methyl naphthalene or other aromatic hydrocarbons, isopropanol, ethyleneglycol, cellosolve or other alcohols, acetone, cyclohexanone, isophorone or other ketones, soybean oil, cottonseed oil or other vegetable oil, dimethyl sulfoxide, acetonitrile, water etc case of this formulating as liquid carrier.

As boundary surfactant, you can list for example alkyl sulfuric acid ester salt, alkyl (aryl) sulfonate, dialkyl sulfosuccinic acid salt, polyoxyethylene alkyl aryl ether phosphoric acid ester salt, naphthalene sulfonic acid formalin condensate or other anionic surfactant, polyoxyethylene alkyl ether, polyoxyethylene alkyl polyoxypropylene block copolymer, sorbitan fatty acid ester or other nonionic surfactant etc.

As auxiliary agent for formulation, for example lignin sulfonate, alginate, poly vinyl alcohol, gum arabic, CMC (carboxymethyl cellulose), you can list PAP (isopropyl acid phosphate) etc.

As application method of the compound of this invention, you can list foliage spreading, soil treatment, seed disinfection etc concretely, furthermore, usually, you can use even with application method person skilled in the art the utilization sharply way.

【0017】

When the compound of this invention it uses, as active ingredient of horticultural microbicide application amount of the active ingredient can change with extent of occurrence, formulation type, application method, application time, atmospheric conditions etc of types, disease of types, target disease of the object plant (crop etc), but per 1 are they are usually 0.01 - 50 g, preferably 0.05~10g.

Diluting emulsion, wettable, suspension etc with water, when application it does, the application concentration, 0.0001 - 0.5%, with preferably 0.0005~0.2%, application does that way the powder, granule etc what without diluting.

【0018】

Be able to use the compound of this invention, as farmland, paddy field, orchard, tea orchard, pasture, turf or other horticultural microbicide mixing with other horticultural microbicide, you can expect also reinforcement of sterilization effectiveness by using.

for example propiconazole, triadimenol, prochloraz, penconazole, tebuconazole, flusilazole, diniconazole,

ラズ、ベンコナゾール、テブコナゾール、フルシラゾール、ジニコナゾール、フロムコナゾール、エポキシコナゾール、ジフェノコナゾール、シプロコナゾール、メトコナゾール、トリフルミゾール、テトラコナゾール、マイクロブタニル、フェンブコナゾール、ヘキサコナゾール、フルキンコナゾール、トリテコナゾール、ビテルタノール、イマザリル及びフルトリアホル等のアゾール系殺菌化合物、フェンプロピモルフ、トリデモルフ及びフェンプロピジン等の環状アミン系殺菌化合物、カルベンダジム、ベノミル、チアベンダゾール、チオファネートメチル等のベンズイミダゾール系殺菌化合物、プロシミドン、シプロディニル、ピリメタニル、ジエトフェンカルブ、チウラム、フルアジナム、マンコゼブ、イプロジオン、ピンクロゾリン、クロロタロニル、キャプタン、メパニピリム、フェンピクロニル、フルジオキサニル、ジクロフルアニド、フォルペット、クレソキシムメチル、アゾキシストロビン、N-メチル- α -メトキシイミノ-2-[(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニルアセトアミド等があげられる。

【0019】

本発明化合物は、他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物生長調節剤、肥料と混用または併用することもできる。

かかる殺虫剤及び/または殺ダニ剤及び/または殺線虫剤としては、例えばフェニトロチオン [O,O-ジメチル O-(3-メチル-4-ニトロフェニル)ホスホロチオエート]、フェニチオン [O,O-ジメチル O-(3-メチル-4-(メチルチオ)フェニル)ホスホロチオエート]、ダイアジノン [O,O-ジエチル-O-2-イソプロピル-6-メチルピリミジン-4-イルホスホロチオエート]、クロルピリホス [O,O-ジエチル-O-3,5,6-トリクロロ-2-ピリジルホスホロチオエート]、アセフェート [O,S-ジメチルアセチルホスホラミドチオエート]、メチダチオン [S-2,3-ジヒドロ-5-メトキシ-2-オキソ-1,3,4-チアジアゾール-3-イルメチル O,O-ジメチルホスホロジチオエート]、ジスルホトン [O,O-ジエチル S-2-エチルチオエチルホスホロチオエート]、DDVP [2,2-ジクロロビニルジメチルホスフェート]、スルプロホス [O-エチル O-4-(メチルチオ)フェニル S-プロピルホスホロジチオエート]、シアノホス [O-4-シアノフェニル O,O-ジメチルホスホロチオエート]、ジオキサベンゾホス [2-メトキシ-4H-1,3,2-ベンゾジオキサホスフィニン-2-スルフィド]、ジメトエート [O,O-ジメチル-S-(N-メチルカルバモイルメチル)ジチオホスフェート]、フェントエート [エチル 2-ジメトキシホスフィノチオイルチオ (フェニル)アセテート]、マラチオン [ジエチル (ジメトキシホスフィノチオイルチオ)サクシネート]、トリクロロホン [ジメチル 2,2,2-トリクロロ-1-ヒドロキシエチルホスホネート]、アジンホスメチル [S-3,4-

bromuconazole, epoxyconazole, difenconazole, cyproconazole, metconazole, triflumizole, tetraconazole, myclobutanil, fenbuconazole, hexaconazole, fluquinconazole, tri T. conazole, bitertanol, imazalil and full thoria hole or other azole fungicidal compound, fenpropimorph, tridemorph and fenpropidin or other cyclic amine fungicidal compound, carbendazim, benomyl, tiabendazole, thiophanate-methyl or other benzimidazole fungicidal compound, procymidone, cyprodinil, [pirimethaniru], the diethofencarb, thiuram, fluazinam, mancozeb, iprodione, vinclozolin, chlorthalonil, captan, mepanipyrim, fenpiclonil, fludioxonil, dichlofluanid, folpet, kresoxim methyl, azoxystrobin, N-methyl-;al-methoxyimino-2- you can list { (2 and 5 -dimethyl phenoxy) methyl } phenyl acetamide etc as other horticultural microbicide which it can mix.

【0019】

the compound of this invention can also jointly use other horticultural insecticide, miticide, nematocide, herbicide, plant growth regulator, fertilizer and blend or.

1, 2, 3, 4, 5 and 6 -hexachloro cyclohexane *, 1, 1- bis (chlorophenyl) - 2, 2 and 2 -trichloroethanol or other chlorinated hydrocarbon compound, chlorflazuron {1 - Osamu - 3 - (2 and 6 -difluoro benzoyl) urea }, teflubenzuron {1 - (3 and 5 -dichloro -2, 4- difluoro phenyl) - 3 - (2 and 6 -difluoro benzoyl) urea }, flufenoxuron {1 - (4 - (2 -chloro -4- trifluoromethyl phenoxy) - 2 -fluorophenyl) - 3 - (2 and 6 -difluoro benzoyl) urea } or other benzoyl phenyl urea compound, amitraz broadax, chlordimeform {N' - (4 -chloro -2- methylphenyl) -N, N- dimethyl methanimidamide } or other formamidine derivative, diafenthiuron {N- (2 and 6 -diisopropyl -4- phenoxy phenyl) -N' -t- butyl carbodiimide } or other thiourea derivative, phenylpyrazole compound, tebfenozide {N- t-butyl -N' - (4 -ethyl benzoyl) - 3 and 5 -dimethyl benzo hydrazide }, 4 -bromo -2- (4 -chlorophenyl) - 1 -ethoxymethyl -5-trifluoromethyl pyrrole -3- carbonitrile, bromopropylate {isopropyl 4, 4' -dibromo benzilate }, tetradifon {4 -chlorophenyl 2, 4, 5-trichlorophenyl sulfone }, quinomethionate {S, S-6-methyl quinoxaline -2, 3- di yl dithio carbonate }, propargite {2 - (4 -t- butylphenoxy) cyclohexyl prop -2- yl sulphite }, fenbutatin oxide {bis {tris (2 -methyl -2- phenyl propyl) tin } oxide }, hexythiazox { (4 RS, 5RS) - 5 - (4 -chlorophenyl) -N- chloro hexyl -4- methyl -2- oxo -1, 3- thiazolidine -3- carboxamide }, clofentezine {3 and 6 -bis (2 -chlorophenyl) - 1, 2, 4 and 5 -tetrazine }, pyridathiopen {2 -t- butyl -5- (4 -t- butyl benzyl thio) - 4

ジヒドロ-4-オキソ-1,2,3-ベンゾトリアジン-3-イル
 メチル O,O'-ジメチルホスホロジチオエト],モノ
 クロトホス[ジメチル(E)-1-メチル-2-(メチルカル
 バモイル)ビニルホスフェ-ト],エチオン
 [O,O',O'-テトラエチル S,S'-メチレンビス(ホ
 スホロジチオエト)],ホスチアゼト[N-(O-メチル
 -S-sec -ブチル)ホスホリルチアゾリジン-2-オン]
 等の有機リン系化合物、BPMC(2-sec -ブチルフェ
 ニルメチルカルバメト)、ベンフラカルブ[エチ
 ル N-(2,3-ジヒドロ-2,2-ジメチルベンゾフラン-7-
 イルオキシカルボニル(メチル)アミノチオ)-N-イ
 ソプロピル-β-アラニネト)、プロポキシル[2-イ
 ソプロポキシフェニル N-メチルカルバメト)、カル
 ボスルファン[2,3-ジヒドロ-2,2-ジメチル-7-ベン
 ゾ[b]フラニル N-ジブチルアミノチオ-N-メチ
 ルカ-バメト)、カルバリル[1-ナフチル-N-メチル
 カ-バメト)、メソミル[S-メチル-N-(メチルカルバ
 モイル)オキシ]チオアセトイミドト)、エチオフェ
 ンカルブ[2-(エチルチオメチル)フェニルメチルカ
 -バメト)、アルジカルブ[2-メチル-2-(メチルチオ)
 プロピオンアルデヒド O-メチルカルバモイルオ
 キシム)、オキサミル[N,N-ジメチル-2-メチルカル
 バモイルオキシイミノ-2-(メチルチオ)アセタミ
 ド)、フェノチオカルブ[S-4-フェノキシブチル
 -N,N-ジメチルチオカ-バメト等のカ-バメト系化
 合物、エトフェンプロックス[2-(4-エトキシフェ
 ニル)-2-メチルプロピル-3-フェノキシベンジルエ
 テル)、フェンパレレト[(RS)-α-シアノ-3-フェノ
 キシベンジル (RS)-2-(4-クロロフェニル)-3-メチ
 ルブチレト)、エスフェンパレレト[(S)-α-シアノ-3-
 フェノキシベンジル (S)-2-(4-クロロフェニル)-3-
 メチルブチレト)、フェンプロパトリン[(RS)-α-シ
 アノ-3-フェノキシベンジル 2,2,3,3-テトラメチ
 ルシクロプロパンカルボキシレト)、シベルメトリ
 ン[(RS)-α-シアノ-3-フェノキシベンジル
 (1RS,3RS)-3-(2,2-ジクロロビニル)-2,2-ジメチ
 ルシクロプロパンカルボキシレト)、ペルメトリ
 ン[3-フェノキシベンジル(1RS,3RS)-3-(2,2-ジクロ
 ロビニル)-2,2-メチルシクロプロパンカルボキシ
 レト)、シハロトリン[(RS)-α-シアノ-3-フェノ
 キシベンジル (Z)-(1RS,3RS)-3-(2-クロロ-3,3,3-トリ
 フロオプロペニル)-2,2-ジメチルシクロプロパ
 ンカルボキシレト)、デルタメトリン[(S)-α-シア
 ノ-m-フェノキシベンジル (1R,3R)-3-(2,2-ジプロ
 モビニル)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボ
 キシレト)、シクロプロスリン[(RS)-α-シアノ-3-フェ
 ノキシベンジル (RS)-2,2-ジクロロ-1-(4-エトキシ
 フェニル)シクロプロパンカルボキシレト)、フルバ
 リネト [α-シアノ-3-フェノキシベンジル N-(2-ク
 ロロ-α,α,α-トリフルオロ-p-トリル)-D-バリネ
 ト)、ピフエンズリン[2-メチルビフェニル-3-イルメ
 チル(Z)-(1RS)-cis-3-(2-クロロ-3,3,3-トリフル
 オロプロ-1-エニル)-2,2-ジメチルシクロプロパ
 ンカ

-chloro pyridazine -3 (2 H) -on }, fenpyroximate {t- butyl
 (E) - 4 - { (1 and 3 - [jimechiru] - 5 - [fenokishipirazo] -
 [ru] - 4 - [iru]) [mechirenaminookishimechiru] } [benzoe] -
 [to] }, [tebufenpirado] {N-4-tert- [buchirubenjiru] } - 4 -
 [kuroro] - 3 - [echiru] - 1 - [mechiru] - 5 - [pirazo] -
 [rukarubokisamido] }, [porinakuchinkonpurekkusu]
 { [teteranakuchin] [jinakuchin]
 [torinakuchin] }, [mirubemekuchin], [aburumekuchin], [iba]
 - [mekuchin], [azajirakuchin] {AZAD }, [pirimijifen] {5 -
 [kuroro] -N- {2 - {4 - (2 - [etokishiechiru]) - 2 and 3 -
 [jimechirufenokishi] } [echiru] } - 6 - [echirupirimijin] - 4 -
 [amin], [pimetrojin] {2, 3, 4 and 5 - [teterahidoro] - 3 -
 [okiso] - 4 - { ([pirijin] - 3 - [iru]) - [mechirenamino] } - 6
 - [mechiru] - 1, 2 and 4 - it can increase [toriajin] etc. } } S,
 S' - (2 - dimethylamino trimethylene) bis
 (thiocarbamate), thiocyclam {N, N- dimethyl -1, 2, 3-
 trithian -5-ylamine }, bensultap {S, S' -2-
 dimethylamino trimethylene di (benzene thio sulfonate) } or
 other nereitoxin derivative , N- cyano -N' -methyl
 -N' - (6 -chloro -3- pyridyl methyl) acetamidine or
 other N- cyano amidine derivative , endosulfan {6, 7, 8, 9, 10
 and 10 -hexachloro -1, 5, 5a, 6, 9, 9a-hexahydro -6,
 9-methano -2, 4, 3- benzodioxathiepinoxide }, gamma -BHC
 {4 -ethoxy phenyl (3 - (4 -fluoro -3- phenoxy phenyl)
 propyl) dimethylsilane } or other pyrethroid compound ,
 buprofezin (2 -t- butylimino -3- isopropyl -5-phenyl -1, 3,
 5-thiadiazinan -4- on) or other thiadiazine derivative ,
 imidacloprid {1 - (6 -chloro -3- pyridyl methyl) -N- nitro
 imidazolidine -2- indene amine } or other nitro imidazolidine
 derivative , cartap 1 R- {1;al (S*), 3;al (Z) } } - 2 and 2
 -dimethyl -3- {3 -oxo -3- (2, 2 and 2 -trifluoro -1-
 (trifluoromethyl) ethoxy -1- propenyl
 *cyclopropanecarboxylic acid cyano (3 -phenoxy phenol)
 methyl ester) } , 2 -methyl -2- (4 -bromo difluoro
 methoxyphenyl) propyl (3 -phenoxybenzyl) ether ,
 tralomethrin Chikashi,silaneophan S-4- phenoxy butyl -N,
 N- dimethyl thiocarbamate or other carbamate type compound ,
 ethofenprox {2 - (4 -ethoxy phenyl) - 2 -methylpropyl -3-
 phenoxybenzyl ether }, fenvalerate { (RS) -;al -cyano -3-
 phenoxybenzyl (RS) - 2 - (4 -chlorophenyl) - 3 -methyl
 butanoate }, esfenvalerate { (S) -;al -cyano -3-
 phenoxybenzyl (S) - 2 - (4 -chlorophenyl) - 3 -methyl
 butanoate }, fenprothrin { (RS) -;al -cyano -3-
 phenoxybenzyl 2, 2, 3, 3- tetramethyl cyclopropane
 (INN1395) carboxylate }, cypermethrin { (RS) -;al -cyano
 -3- phenoxybenzyl (1 RS, 3RS) - 3 - (2 and 2 -dichlorovinyl)
 - 2 and 2 -dimethyl cyclopropane (INN1395) carboxylate },
 permethrin {3 -phenoxybenzyl (1 RS, 3RS) - 3 - (2 and 2
 -dichlorovinyl) - 2 and 2 -methyl cyclopropane (INN1395)
 carboxylate }, cyhalothrin { (RS) -;al -cyano -3-
 phenoxybenzyl (Z) - (1 RS, 3RS) - 3 - (2 -chloro -3, 3, 3- tri
 fluoro propenyl) - 2 and 2 -dimethyl cyclopropane
 (INN1395) carboxylate },deltamethrin { (S) -;al -cyano

ルボキシラ-ト)、アクリナスリン[(1R-{1 α (S*), 3 α (Z)})-2,2-ジメチル-3-[3-オキソ-3-(2,2,2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エトキシ-1-プロペニル]シクロプロパンカルボン酸シアノ(3-フェノキシフェノール)メチルエステル)、2-メチル-2-(4-ブロモジフルオロメトキシフェニル)プロピル(3-フェノキシベンジル)エ-テル、トラロメスリン[(S)- α -シアノ-3-フェノキシベンジル (1R)-シス-3-(1,2,2,2-テトラブロモエチル)-2,2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート]、シラフルオフェン[[4-エトキシフェニル(3-(4-フルオロ-3-フェノキシフェニル)プロピル)ジメチルシラン]等のピレスロイド化合物、ブプロフェジン(2-tert-ブチルイミノ-3-イソプロピル-5-フェニル-1,3,5-トリアジアジン-4-オン)等のチアジジン誘導体、イミダクロプリド[1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロイミダゾリジン-2-インデンアミン]等のニトロイミダゾリジン誘導体、カルタップ(S,S')-(2-ジメチルアミノトリメチレン)ビス(チオカ-バメト)、チオシクラム[N,N-ジメチル-1,2,3-トリチアン-5-イルアミン]、ベンスルタップ[S,S']-(2-ジメチルアミノトリメチレン ジ(ベンゼンチオサルフォネート))等のネライストキシン誘導体、N-シアノ-N'-メチル-N'-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アセトアミジン等の N-シアノアミジン誘導体、エンドスルファン[6,7,8,9,10,10-ヘキサクロロ-1,5,5a,6,9,9a-ヘキサヒドロ-6,9-メタノ-2,4,3-ベンゾジオキサチエピンオキサイド]、gamma-BHC(1,2,3,4,5,6-ヘキサクロロシクロヘキサン)、1,1-ビス(クロロフェニル)-2,2,2-トリクロロエタノール等の塩素化炭化水素化合物、クロルフルアズロン[1-(3,5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル)-3-(2,6-ジフルオロベンゾイル)ウレア]、テフルベンズロン[1-(3,5-ジクロロ-2,4-ジフルオロフェニル)-3-(2,6-ジフルオロベンゾイル)ウレア]、フルフェノクスロン[1-(4-(2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-フルオロフェニル)-3-(2,6-ジフルオロベンゾイル)ウレア]等のベンゾイルフェニルウレア系化合物、アミトラズ[N,N'[(メチルイミノ)ジメチリジン]ジ-2,4-キシリジン]、クロルジメホルム[N'-(4-クロロ-2-メチルフェニル)-N,N-ジメチルメチニダミド]等のホルムアミジン誘導体、ジアフェンチウロン[N-(2,6-ジイソプロピル-4-フェノキシフェニル)-N'-tert-ブチルカルボジイミド]等のチオ尿素誘導体、フェニルピラゾール系化合物、テブフェンジド[N-tert-ブチル-N'-(4-エチルベンゾイル)-3,5-ジメチルベンゾヒドラジド]、4-ブロモ-2-(4-クロロフェニル)-1-エトキシメチル-5-トリフルオロメチルピロ-ル-3-カルボニトリル、プロモプロピレート[イソプロピル 4,4'-ジプロモベンジレート]、テトラジホン[4-クロロフェニル 2,4,5-トリクロロフェニルスルホン]、キノメチオネ-ト[S,S-6-メ

-m-phenoxybenzyl (1 R, 3R) - 3 - (2 and 2 -dibromo vinyl) - 2 and 2 -dimethyl cyclopropane (INN1395) carboxylate }, cyclo prothrin { (RS) -;al -cyano -3- phenoxybenzyl (RS) - 2 and 2 -dichloro -1- (4 -ethoxy phenyl) cyclopropane (INN1395) carboxylate }, fluvalinate {;al -cyano -3- phenoxybenzyl N- (2 -chloro -;al;al and;al -trifluoro -p-tolyl) -D-valinate }, bifenthrin {2 -methylbiphenyl -3- yl methyl (Z) - (1 RS) -cis-3- (2 -chloro -3, 3, 3- trifluoro prop -1- enyl) - 2 and 2 -dimethyl cyclopropane (INN1395) carboxylate }, acrinathrin 2 and 3 -dihydro -2, 2- dimethyl benzofuran -7-yloxy carbonyl (methyl) amino thio *-N- isopropyl -;be -alaninate *, propoxur {2 -isopropoxy phenyl N- methyl carbamate }, carbosulfan {2 and 3 -dihydro -2, 2- dimethyl -7-benzo [b] furanyl N- dibutyl amino thio -N- methyl carbamate }, carbaryl {1 -naphthyl -N- methyl carbamate }, methomyl {S-methyl -N- { (methyl carbamoyl) oxy } thio aceto imidate },ethiofencarb {2 - (ethyl thio methyl) phenylmethyl carbamate }, aldicarb {2 -methyl -2- (methylthio) propionaldehyde O-methyl carbamoyl oxime }, oxamyl {N, N- dimethyl -2- methyl carbamoyl oxy imino -2- (methylthio) acetamide }, fenothiocarb ethyl N- 2 -s-butyl phenylmethyl carbamate *, benfuracarb As this insecticide and/or miticide and/or nematocide , for example fenitrothion {O, O-dimethyl O- (3 -methyl -4- nitrophenyl) phosphorothioate }, fenthion {O, O-dimethyl O- (3 -methyl -4- (methylthio) phenyl) phosphorothioate }, diazinon {O, O-diethyl -O-2- isopropyl -6-methyl pyrimidine -4- yl phosphorothioate }, chlorpyrifos {O, O-diethyl -O-3, 5, 6-trichloro -2- pyridyl phosphorothioate }, acephate {O, S-dimethyl acetyl phosphoramidate thioate }, methidathion {S-2, 3- dihydro -5-methoxy -2- oxo -1, 3, 4- thiadiazole -3- yl methyl O, O-dimethyl phosphorodithioate }, di sulfo ton {O, O-diethyl S-2- ethyl thio ethyl phosphorothioate }, DDVP {2 and 2 -dichlorovinyl dimethyl phosphate }, sulprofos {O-ethyl O-4- (methylthio) phenyl S-propyl phosphorodithioate },cyanophos {O-4- cyanophenyl O, O-dimethyl phosphorothioate }, dioxabenzophos {2 -methoxy -4H-1, 3, 2- benzo dioxa phosphinine -2- sulfide }, dimethoate {O, O-dimethyl -S- (N- methyl carbamoyl methyl) dithio phosphate }, phenthoate {ethyl 2- dimethoxy phosphino thioyl thio (phenyl) acetate }, malathion {diethyl (dimethoxy phosphino thioyl thio) succinate },trichlorphon {dimethyl 2, 2, 2- trichloro -1- hydroxyethyl phosphonate }, azinphos-methyl {S-3, 4- dihydro -4- oxo -1, 2, 3- benzo triazine -3- yl methyl O, O-dimethyl phosphorodithioate }, monocrotophos {dimethyl (E) - 1 -methyl -2- (methyl carbamoyl) vinyl phosphate }, ethion {O, O, O*, O*-tetraethyl S, S' -methylene bis (phosphorodithioate) }, fosthiazate {N- (O-methyl -S-s-butyl) phosphoryl thiazolidine -2- on } or other organophosphorus type compound , BPMC S 1 R 1, 2, 2 and 2 -tetrabromoethyl * -;al -cyano -3- phenoxybenzyl Sou -cis -3- * - 2 and 2 -dimethyl cyclopropane (INN1395)

チルキノキサリン-2,3-ジイルジチオカルボネ-
ト)、プロパルゲイト[2-(4-tert-ブチルフェノキシ)
シクロヘキシル プロップ-2-イル スルファイト)、フ
エンブタティン オキシド[ビス[トリス(2-メチル-2-
フェニルプロピル)ティン]オキシド)、ヘキシチア
ゾクス[(4RS,5RS)-5-(4-クロロフェニル)-N-クロ
ロヘキシル-4-メチル-2-オキソ-1,3-チアゾリジン
-3-カルボキサミド)、クロフェンテジン[3,6-ビス
(2-クロロフェニル)-1,2,4,5-テトラジン、ピリダチ
オベン[2-tert-ブチル-5-(4-tert-ブチルベンジルチ
オ)-4-クロロピリダジン-3(2H)-オン]、フェンピロキ
シメト[tert-ブチル(E)-4-[(1,3-ジメチル-5-フェノ
キシピラゾ-ル-4-イル)メチレンアミノオキシメチ
ル]ベンゾエ-ト)、テブフェンピラド[N-4-tert-ブチ
ルベンジル]-4-クロロ-3-エチル-1-メチル-5-ピラ
ゾ-ルカルボキサミド)、ポリナクチンコンプレック
ス[テトラナクチン、ジナクチン、トリナクチン]、ミ
ルベメクチン、アベルメクチン、イバ-メクチン、ア
ザジラクチン[AZAD]、ピリミジフェン[5-クロロ
-N-[2-{4-(2-エトキシエチル)-2,3-ジメチルフェノ
キシ}エチル]-6-エチルピリミジン-4-アミン、ピメ
トロジン[2,3,4,5-テトラヒドロ-3-オキソ-4-[(ピリジ
ン-3-イル)-メチレンアミノ]-6-メチル-1,2,4-トリア
ジン等があげられる。]]]

[0020]

本発明化合物により防除することができる植物
病害としては例えば以下のような病害をあげる
ことができる。

イネのいもち病(Pyricularia oryzae)、

ごま葉枯病(Cochliobolus miyabeanus)、

紋枯病(Rhizoctonia solani)、

ムギ類のうどんこ病(Erysiphe graminis)、

赤かび病(Gibberella zeae)、

さび病(Puccinia striiformis, P. graminis, P.
recondita, P. hordei)、

雪腐病(Typhula sp., Micronectriella nivalis)、

裸黒穂病 (Ustilago tritici, U. nuda)、

なまぐさ黒穂病 (Tilletia caries)、

眼紋病(Pseudocercospora herpotrichoides)、

雲形病(Rhynchosporium secalis) 、

葉枯病(Septoria tritici)、

ふ枯病(Leptosphaeria nodorum)、

carboxylate 3 -chloro -5-trifluoromethyl pyridine -2- yloxy 3
and 5 -dichloro -4- * phenyl (methyl imino) dimethylidine N,
N' * di- 2, 4- xylidine

[0020]

Like below for example it is possible as plant disease which
can be prevented with the compound of this invention to
increase disease .

rice blast of rice (Pyricularia oryzae),

Cochliobolus miyabeanus (Cochliobolus miyabeanus),

Rhizoctonia solani (Rhizoctonia solani),

powdery mildew of winter cereals (Erysiphe graminis),

Fusarium rot (Gibberella zeae),

rust (Puccinia striiformis , P. graminis , P. recondita, P.
hordei),

Typhula sp., Micronectriella nivalis (Typhula sp.,
Micronectriella nivalis),

Ustilago tritici, Ustilago nuda (Ustilago tritici, U. nuda),

Lintel black ear illness (Tilletia caries),

eyespot (Pseudocercospora herpotrichoides),

Rhynchosporium secalis (scald) (Rhynchosporium secalis),

speckled leaf blotch of wheat & barley (Septoria tritici)
(Septoria tritici),

glume blotch of wheat & barley (Leptosphaeria
nodorum) (Leptosphaeria nodorum),

カンキツ類の黒点病(<i>Diaporthe citri</i>)、	fruit spot of <i>Citrus</i> spp., <i>Poncirus</i> spp., <i>fortunella</i> spp. (citrus) (<i>Diaporthe citri</i>),
そうか病(<i>Elsinoe fawcetti</i>) 、	scab (<i>Elsinoe fawcetti</i>),
果実腐敗病 (<i>Penicillium digitatum</i> , <i>P. italicum</i>) 、	<i>Penicillium digitatum</i> , <i>Penicillium italicum</i> (fruit spoilage disease) (<i>Penicillium digitatum</i> , <i>P. italicum</i>),
リンゴのモニリア病 (<i>Sclerotinia mali</i>) 、	blossom blight of <i>Malus pumila</i> Miller var. <i>domestica</i> Schneider (apple) (<i>Sclerotinia mali</i>),
腐らん病 (<i>Valsa mali</i>) 、	canker (<i>Valsa mali</i>),
うどんこ病(<i>Podosphaera leucotricha</i>)、	powdery mildew (<i>Podosphaera leucotricha</i>),
斑点落葉病(<i>Alternaria mali</i>)、	<i>Alternaria</i> leaf spot (<i>Alternaria mali</i>),
黒星病(<i>Venturia inaequalis</i>)、	scab (<i>Venturia inaequalis</i>),
ナシの黒星病(<i>Venturia nashicola</i> , <i>V. pirina</i>)、	scab of pear (<i>Venturia nashicola</i> , <i>V. pirina</i>),
黒斑病(<i>Alternaria kikuchiana</i>)、	Phoma rot (<i>Alternaria kikuchiana</i>),
赤星病(<i>Gymnosporangium haraeum</i>)、	rust (<i>Gymnosporangium haraeum</i>),
モモの灰星病(<i>Sclerotinia cinerea</i>)、	brown rot of <i>Prunus persica</i> Batsch. (<i>Sclerotinia cinerea</i>),
黒星病(<i>Cladosporium carpophilum</i>) 、	scab (<i>Cladosporium carpophilum</i>),
フオモプシス腐敗病(<i>Phomopsis</i> sp.)、	Phomopsis rot (<i>Phomopsis</i> sp.) (<i>Phomopsis</i> sp.),
ブドウの黒とう病(<i>Elsinoe ampelina</i>) 、	grape anthracnose (<i>Elsinoe ampelina</i>) (<i>Elsinoe ampelina</i>),
晩腐病(<i>Glomerella cingulata</i>) 、	ripe rot (<i>Glomerella cingulata</i>),
うどんこ病(<i>Uncinula necator</i>) 、	powdery mildew (<i>Uncinula necator</i>),
さび病 (<i>Phakopsora ampelopsidis</i>)、	rust (<i>Phakopsora ampelopsidis</i>),
ブラックロット病(<i>Guignardia bidwellii</i>) 、	black lot illness (<i>Guignardia bidwellii</i>),
べと病(<i>Plasmopara viticola</i>)、	downy mildew (<i>Plasmopara viticola</i>),
カキの炭そ病(<i>Gloeosporium kaki</i>)、	anthracnose of persimmon (<i>Gloeosporium kaki</i>),
落葉病 (<i>Cercospora kaki</i> , <i>Mycosphaerella nawae</i>)、	<i>Cercospora kaki</i> , <i>Mycosphaerella nawae</i> (leaf spot) (<i>Cercospora kaki</i> , <i>Mycosphaerella nawae</i>),
ウリ類の炭そ病(<i>Colletotrichum lagenarium</i>)、	anthracnose of cucurbitaceous fruit (<i>Colletotrichum lagenarium</i>),
うどんこ病(<i>Sphaerotheca fuliginea</i>) 、	powdery mildew (<i>Sphaerotheca fuliginea</i>),
つる枯病 (<i>Mycosphaerella melonis</i>) 、	<i>Mycosphaerella melonis</i> (black rot) (<i>Mycosphaerella melonis</i>),
つる割病 (<i>Fusarium oxysporum</i>) 、	dead arm (<i>Fusarium oxysporum</i>),
べと病 (<i>Pseudoperonospora cubensis</i>) 、疫病 (<i>Phytophthora</i> sp.) 、苗立枯病 (<i>Pythium</i> sp.)、トマトの輪紋病(<i>Alternaria solani</i>)、葉かび病 (<i>Cladosporium fulvum</i>)、疫病 (<i>Phytophthora infestans</i>) 、ナスの褐紋病 (<i>Phomopsis vexans</i>) 、うどんこ病 (<i>Erysiphe cichoracearum</i>) 、アブラナ科野菜の黒斑病 (<i>Alternaria japonica</i>)、白斑病 (<i>Cercospora</i>)	downy mildew (<i>Pseudoperonospora cubensis</i>), <i>Phytophthora</i> rot (<i>Phytophthora</i> sp.), seedling leaf blight (<i>Pythium</i> sp.), ring rot of tomato (<i>Alternaria solani</i>), <i>Cladosporium fulvum</i> (leaf mold) (<i>Cladosporium fulvum</i>), <i>Phytophthora</i> rot (<i>Phytophthora infestans</i>), * crest illness of eggplant (<i>Phomopsis vexans</i>), powdery mildew (<i>Erysiphe cichoracearum</i>), Phoma rot of Brassicaceae vegetable (<i>Alternaria japonica</i>), white spot of brassica (<i>Cercospora</i>)

brassicae)、ネギのさび病(*Puccinia allii*)、ダイズの紫斑病(*Cercospora kikuchii*)、黒とう病(*Elsinoe glycines*)、黒点病(*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*)、インゲンの炭そ病(*Colletotrichum lindemthianum*)、ラッカセイの黒渋病(*Cercospora personata*)、褐斑病(*Cercospora arachidicola*)、エンドウのうどんこ病(*Erysiphe pisi*)、ジャガイモの夏疫病(*Alternaria solani*)、疫病(*Phytophthora infestans*)、イチゴのうどんこ病(*Sphaerotheca humuli*)、チャの網もち病(*Exobasidium reticulatum*)、白星病(*Elsinoe leucospila*)、タバコの赤星病(*Alternaria longipes*)、うどんこ病(*Erysiphe cichoracearum*)、炭そ病(*Colletotrichum tabacum*)、べと病(*Peronospora tabacina*)、疫病(*Phytophthora nicotianae*)、テンサイの褐斑病(*Cercospora beticola*)、バラの黒星病(*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病(*Sphaerotheca pannosa*)、キクの褐斑病(*Septoria chrysanthemi-indici*)、白さび病(*Puccinia horiana*)、種々の作物の灰色かび病(*Botrytis cinerea*)、菌核病(*Sclerotinia sclerotiorum*)等

【0021】

【実施例】

以下、本発明を製造例、製剤例及び試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明は、これらの例のみに限定されるものではない。

まず、製造例を示す。

尚、本発明化合物の番号は後記表 1~表 56 に記載の化合物番号である。

製造例 1〔前記スキーム 化 3 の工程 3a の例〕

メチル 2-{5-(1-ベンジルオキシイミノエチル)-2-メチルフェノキシ}-3-ヒドロキシアクリレート 500mg(1.41mmol)、トリフェニルフォスフィン 0.74g(2.82mmol)、四塩化炭素 7.71ml(7.53mmol)、テトラヒドロフラン 8.5ml の混合物を 3 時間加熱還流した。

室温下放冷の後、反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮し、残さをシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して目的とするメチル 2-{5-(1-ベンジルオキシイミノエチル)-2-メチルフェノキシ}-3-クロロアクリレート(本発明化合物 239)250mg(収率

brassicae) (*Cercospora brassicae*), rust of onion (*Puccinia allii*), purple stain of soybean (*Cercospora kikuchii*) (*Cercospora kikuchii*), *Elsinoe glycines* (anthracnose) (*Elsinoe glycines*), fruit spot (*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*), anthracnose of kidney bean (*Colletotrichum lindemthianum*), *Mycosphaerella personatum* of *Arachis hypogaea* L. (*Cercospora personata*), * mottling illness (*Cercospora arachidicola*), powdery mildew of *Pisum sativum* L. (garden pea) (*Erysiphe pisi*), *Alternaria solani* of potato (*Alternaria solani*), *Phytophthora rot* (*Phytophthora infestans*), powdery mildew of strawberry (*Sphaerotheca humuli*), *Exobasidium reticulatum* of *Thea sinensis* L. (tea) (*Exobasidium reticulatum*), *Elsinoe leucospila* (white star disease) (*Elsinoe leucospila*), rust of tobacco (*Alternaria longipes*), powdery mildew (*Erysiphe cichoracearum*), anthracnose (*Colletotrichum tabacum*), downy mildew (*Peronospora tabacina*), *Phytophthora rot* (*Phytophthora nicotianae*), * mottling illness of *Beta vulgaris* L. var *saccharifera* Alef. (sugar beet) (*Cercospora beticola*), scab of *Rosa* (rose) (*Diplocarpon rosae*), powdery mildew (*Sphaerotheca pannosa*), * group illness of *Chrysanthemum morifolium* Ramat. (*chrysanthemum*) (*Septoria chrysanthemi-indici*), white rust (*Puccinia horiana*), gray mold of fruit of various crop (*Botrytis cinerea*), *Sclerotinia rot* (*Sclerotinia sclerotiorum*) etc

【0021】

【Working Example(s)】

Below, this invention furthermore is explained in detail with Production Example , Formulation Example and Test Example etc, but this invention is not something where are limited as only these examples.

First, Production Example is shown.

Furthermore number of the compound of this invention is compound number which is stated in the postscript Table 1 ~Table 56.

Production Example 1 {Example of step 3a of aforementioned scheme Chemical Formula 3 }

methyl 2- {5 - (1 -benzyloxy imino ethyl) - 2 -methyl phenoxy } - 3 -hydroxy acrylate 500mg (1.41 mmol), triphenyl phosphine 0.74g (2.82 mmol), carbon tetrachloride 7.71ml (7.53 mmol), mixture of tetrahydrofuran 8.5ml 3 hours heating and refluxing was done.

After cooling under room temperature , it filtered reaction mixture , vacuum concentration did filtrate , methyl 2- which attaching on silica gel column chromatography , designates the residue as objective {5 - (1 -benzyloxy imino ethyl) - 2 -methyl phenoxy } - 3 -chloro acrylate (the compound of this

47%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃, TMS)

δ (ppm): 7.3-7.5(5H), 7.1-7.3(2H), 7.21(1H, s), 6.98(1H, br. s), 5.19(2H, s), 3.73(3H, s), 2.36(3H, s), 2.17(3H, s); de (ppm): 7.3 - 7.5 (5 H), 7.1 - 7.3 (2 H), 7.21 (1 H, s), 6.98 (1 H, br. s), 5.19 (2 H, s), 3.73(3 H, s), 2.36 (3 H, s), 2.17 (3 H, s)

【0022】

参考製造例 1〔前記スキーム 化 4 の工程 4 の例〕

アルゴン雰囲気下、氷冷下、攪拌中の、水素化カリウム (35% オイル ディス パ - ジ ョ ン) 12g (108mmol) 及び 1、2-ジメトキシエタン 160ml の混合物に、メチル 2-{5-(1-ベンジルオキシイミノエチル)-2-メチルフェノキシ}アセテート 16g (49mmol)、ギ酸メチル 29g (490mmol) 及び 1、2-ジメトキシエタン 10ml の混合溶液を滴下した。

その後、徐々に室温まで昇温しつつ 3 時間攪拌を続けた。

反応液を氷に注加し、これをジエチルエーテルで 2 回洗浄後、水層を希塩酸中に注加し、これを酢酸エチルで抽出した。

酢酸エチル層を水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮して、目的とするメチル 2-{5-(1-ベンジルオキシイミノエチル)-2-メチルフェノキシ}-3-ヒドロキシアクリレート(本発明化合物の合成中間体化合物) 15g (約 41mmol) を得た。

¹H-NMR(TMS, CDCl₃) (複数の異性体の混合物)

δ (ppm): 8.01(1Hx1/2, s), 7.55(1Hx1/3, s), 7.28-7.5(m), 7.1-7.2(2H, m), 5.23(2Hx1/2, s), 5.2(2Hx1/2, s), 4.72(3Hx1/3, s), 3.68(3Hx1/2, s), 3.55(3Hx

invention 239) it acquired 250 mg (yield 47%).

¹H-nmr (CDCl₃, TMS)

[0022]

Reference Example 1 {Example of step 4 of aforementioned scheme Chemical Formula 4 }

It is under argon atmosphere and in midst of under ice cooling , agitating, potassium hydride (35% oil dispersion) 12 g (108 mmol) and 1 and 2 -dimethoxyethane 160ml in mixture , methyl 2- { 5 - (1 -benzyloxy imino ethyl) - 2 -methyl phenoxy } acetate 16g (49 mmol), methyl formate 29g (490 mmol) and 1 and 2 -dimethoxyethane 10ml mixed solution was dripped.

After that, while temperature rise doing gradually to room temperature , it continued 3 hours churning.

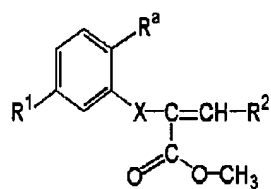
reaction mixture was added to ice , this after twice washing, water layer was added in dilute hydrochloric acid with diethyl ether , this was extracted with the ethylacetate .

water wash it did ethyl acetate layer , after drying with magnesium sulfate ,concentrating, methyl 2- which it makes objective { 5 - (1 -benzyloxy imino ethyl) - 2 -methyl phenoxy } - 3 -hydroxy acrylate (synthetic intermediate compound of the compound of this invention) itacquired 15 g (Approximately 41 mmol).

¹H-nmr (TMS , CDCl₃) (mixture of isomer of plural)

【0023】

次に本発明化合物の例を化合物番号と共に表1~56に示す。



で示される化合物。

【0024】

【表 1】

[0023]

Example of the compound of this invention with compound number is shown next in Table 1 ~56.

So compound . which is shown

[0024]

[Table 1]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1	Ph	H	NMe	Cl
2	Ph	H	O	Cl
3	Ph	H	S	Cl
4	Ph	Me	O	Cl
5	Ph	Et	O	Cl
6	Ph	Cl	O	Cl
7	Ph	Br	O	Cl
8	4-Cl-Ph	Me	O	Cl
9	3-Cl-Ph	Me	O	Cl
10	2-Cl-Ph	Me	O	Cl
11	4-Me-Ph	Me	O	Cl
12	3-Me-Ph	Me	O	Cl
13	2-Me-Ph	Me	O	Cl
14	4-F-Ph	Me	O	Cl
15	3-F-Ph	Me	O	Cl
16	2-F-Ph	Me	O	Cl
17	3, 4-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
18	2, 4-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
19	2, 6-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
20	3, 4-Cl ₂ -Ph	Me	O	Cl
21	Ph	H	NMe	Br
22	Ph	H	S	Br
23	Ph	H	O	Br
24	Ph	Me	O	Br
25	3-Me-Ph	Me	O	Br

【0025】

[0025]

【表 2】

[Table 2]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
26	Et ₃ CC≡C	H	NMe	Cl
27	Et ₃ CC≡C	H	O	Cl
28	Et ₃ CC≡C	H	S	Cl
29	Et ₃ CC≡C	Me	O	Cl
30	Me ₃ SiC≡C	H	NMe	Cl
31	Me ₃ SiC≡C	H	O	Cl
32	Me ₃ SiC≡C	H	S	Cl
33	Me ₃ SiC≡C	Me	O	Cl
34	Et ₃ SiC≡C	Me	O	Cl
35	Me ₂ C(n-Bu)C≡C	Me	O	Cl
36	c-Hex-C≡C	Me	O	Cl
37	4-Cl-PhOC(Me) ₂ C≡C	Me	O	Cl
38	PhOC(Me) ₂ C≡C	Me	O	Cl
39	Me ₂ C(Bu)C≡C	Me	O	Cl
40	Me ₂ C(Ph)C≡C	Me	O	Cl
41	Et ₂ C(OEt)C≡C	Me	O	Cl
42	Et ₂ C(Me)C≡C	Me	O	Cl
43	Et ₃ CC≡C	Cl	O	Cl
44	Me ₃ SiC≡C	Cl	O	Cl
45	Et ₃ SiC≡C	Cl	O	Cl
46	Et ₃ CC≡C	H	NMe	Br
47	Et ₃ CC≡C	H	O	Br
48	Et ₃ CC≡C	H	S	Br
49	Et ₃ CC≡C	Me	O	Br
50	Et ₃ CC≡C	Cl	O	Br

【0026】

[0026]

【表 3】

[Table 3]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
51	Me	H	NMe	Cl
52	Et	H	O	Cl
53	n-Pr	Me	O	Cl
54	n-Bu	Me	O	Cl
55	i-Bu	Cl	O	Cl
56	sec-Bu	Cl	O	Cl
57	n-Pent	H	NMe	Cl
58	n-Hex	H	O	Cl
59	n-ヘプチル	H	O	Cl
60	n-オクチル	Me	O	Cl
61	n-ノニル	H	NMe	Cl
62	n-デシル	H	NMe	Cl
63	t-Bu	H	NMe	Cl
64	EtC(Me)	Me	O	Cl
65	i-PrC(Me)	Me	O	Cl
66	t-BuCH ₂	Me	O	Cl
67	t-BuC(Me) ₂	H	NMe	Cl
68	t-Bu(CH ₂) ₂	H	NMe	Cl
69	t-BuC(Me) ₂ CH ₂	H	NMe	Cl
70	t-Bu(CH ₂) ₃	H	NMe	Cl
71	n-Pr	H	NMe	Br
72	sec-Bu	H	O	Br
73	EtC(Me)	H	O	Br
74	t-Bu	Me	O	Br
75	t-BuCH ₂	Me	O	Br

【0027】

[0027]

【表 4】

[Table 4]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
76	H ₂ C=CH	H	NMe	Cl
77	MeCH=CH	H	O	Cl
78	EtCH=CH	H	S	Cl
79	n-PrCH=CH	Cl	O	Cl
80	n-BuCH=CH	Me	O	Cl
81	n-PentCH=CH	Cl	O	Cl
82	n-HexCH=CH	Br	O	Cl
83	n-ヘプチル-CH=CH	H	O	Cl
84	n-オクチル-CH=CH	H	O	Cl
85	Me ₂ C=CH	Cl	S	Cl
86	Me ₂ C=C (Me)	Me	O	Br
87	MeCH=C (Me)	Me	O	Cl
88	Cl ₂ C=CH	Cl	O	Cl
89	Cl ₂ C=C (Me)	Me	O	Cl
90	Cl ₂ C=C (Cl)	H	O	Cl
91	PhCH ₂ CH=CH	H	O	Cl
92	PhCH ₂ CH=C (Me)	H	S	Cl
93	PhCH ₂ C(Me)=C(Me)	H	NMe	Cl
94	MeOCH=CH	H	O	Cl
95	EtOCH=CH	H	O	Cl
96	n-PrOCH=CH	Me	O	Cl
97	n-BuOCH=CH	H	O	Cl
98	i-PrOCH=CH	H	O	Cl
99	t-BuOCH=CH	H	O	Cl
100	PhOCH=CH	H	O	Cl

【0028】

[0028]

【表 5】

[Table 5]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
101	MeOCH=C (Me)	Me	O	Cl
102	EtOCH=C (Me)	H	NMe	Cl
103	n-PrOCH=C (Me)	H	S	Cl
104	n-BuOCH=C (Me)	H	O	Br
105	i-PrOCH=C (Me)	H	O	Cl
106	t-BuOCH=C (Me)	H	O	Cl
107	PhOCH=C (Me)	Cl	O	Cl
108	MeOC(Me)=C(Me)	H	NMe	Cl
109	EtOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
110	n-PrOC(Me)=C(Me)	H	O	Cl
111	n-BuOC(Me)=C(Me)	Me	O	Cl
112	i-PrOC(Me)=C(Me)	H	O	Cl
113	t-BuOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
114	PhOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
115	MeOC(O)CH=CH	Me	O	Cl
116	MeOC(O)C(Me)=CH	H	O	Br
117	MeOC(O)CH=C(Me)	Me	O	Cl
118	MeOC(O)C(Me)=C(Me)	Cl	O	Cl
119	MeOC(O)C(Cl)=C(Me)	Cl	O	Cl
120	MeOC(O)C(Br)=C(Me)	H	NMe	Cl
121	MeOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	Cl
122	EtOC(O)CH=C(Me)	H	O	Cl
123	EtOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	Cl
124	EtOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	Cl
125	i-PrOC(O)CH=C(Me)	Me	O	Cl

【0029】

[0029]

【表 6】

[Table 6]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
126	i-PrOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	C 1
127	i-PrOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	C 1
128	t-BuOC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
129	t-BuOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	C 1
130	t-BuOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	C 1
131	MeOC(O)C(CO ₂ Me)=C(Me)	H	O	C 1
132	MeOC(O)C(CN)=C(Me)	Me	O	C 1
133	EtOC(O)C(CO ₂ Et)=C(Me)	C 1	O	C 1
134	MeOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
135	EtOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
136	PhCH=C(Me)	Me	O	C 1
137	BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
138	4-Me-BnOCH=C(Me)	H	O	C 1
139	3-Me-BnOCH=C(Me)	H	O	C 1
140	2-Me-BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
141	3,4-Me ₂ -BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
142	PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
143	4-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
144	3-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
145	2-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
146	2,5-Me ₂ -PhOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
147	3,4-Me ₂ -PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
148	Me ₂ NC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
149	(n-Bu) ₂ NC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
150	Me ₂ NC(O)OCH=C(Me)	Me	O	C 1

【0030】

[0030]

【表 7】

[Table 7]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
151	1-シクロヘキセニル	Me	O	C1
152	Py-2-イル	H	NMe	C1
153	Py-3-イル	H	NMe	C1
154	Py-4-イル	H	S	C1
155	6-Cl-Py-2-イル	Me	O	C1
156	6-Cl-Py-3-イル	Me	O	C1
157	2,6-Cl ₂ -Py-3-イル	H	S	C1
158	2-チエニル	Me	O	C1
159	3-チエニル	H	NMe	Br
160	2-フリル	C1	O	C1
161	3-フリル	C1	O	Br
162	2-ベンゾチエニル	H	S	C1
163	3-ベンゾチエニル	H	NMe	C1
164	5-MeO-2-Py	Me	O	C1
165	ピロール-1-イル	H	S	C1
166	2-ピリミジニル	H	S	C1
167	4-ピリミジニル	C1	O	C1
168	1-ピラゾリル	C1	O	C1
169	5-チアゾリル	H	NMe	C1
170	5-オキサゾリル	H	NMe	C1
171	1-インドリル	Me	O	C1
172	2-キノリニル	Me	O	C1
173	3-ピリダジニル	H	S	C1
174	ピリジン-2-イル-1-イル	Me	O	C1
175	ピリジン-3-イル-1-イル	Me	O	C1

【0031】

[0031]

【表 8】

[Table 8]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
176	PhO	H	NMe	Br
177	4-Me-PhO	Me	O	Cl
178	3-Me-PhO	H	NMe	Br
179	2-Me-PhO	Me	O	Cl
180	3, 4-Me-PhO	Me	O	Cl
181	2, 5-Me-PhO	H	S	Br
182	4-Cl-PhO	H	S	Br
183	2-PyO	Me	O	Cl
184	5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ	Me	O	Cl
185	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ	Me	O	Cl
186	4-CF ₃ -PhO	Me	O	Cl
187	ピリミジン-4-イルオキシ	Cl	O	Cl
188	6-Cl-t ⁺ リジン-4-イルオキシ	Me	O	Cl
189	2-シアノ-PhO	Me	O	Cl
190	ピリミジン-2-イルオキシ	H	S	Br
191	Py-2-イルオキシ	H	NMe	Br
192	5-Py-2-イルオキシ	H	NMe	Cl
193	2-ニトロ-PhO	H	NMe	Br
194	BnO	Me	O	Cl
195	4-Me-BnO	Me	O	Cl
196	アリルオキシ	Me	O	Cl
197	プロパルギルオキシ	Me	O	Cl
198	シクロプロピルメチルオキシ	Me	O	Cl
199	i-PrO	H	NMe	Br
200	t-BuO	Cl	O	Cl

【0032】

[0032]

【表 9】

[Table 9]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
201	PhNH	H	NMe	Br
202	5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ	H	S	Cl
203	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ	H	NMe	Cl
204	PhS	Me	O	Cl
205	4-Me-PhS	Me	O	Cl
206	3-Me-PhS	Me	O	Cl
207	2-Me-PhS	Me	O	Cl
208	3, 4-Me ₂ -PhS	Me	O	Cl
209	BnS	Me	O	Cl
210	4-Me-BnS	Me	O	Cl
211	3-Me-BnS	Me	O	Cl
212	2-Me-BnS	Me	O	Cl
213	3, 4-Me ₂ -BnS	Me	O	Br
214	Py-2-イルチオ	H	S	Cl
215	5-CF ₃ -Py-2-イルチオ	Me	O	Cl
216	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルチオ	Me	O	Cl
217	ピリミジン-4-イルチオ	H	S	Cl
218	ピリミジン-2-イルチオ	H	NMe	Cl
219	N-(5-CF ₃ -Py-2-イル)-N-Me-アミノ	Me	O	Cl
220	N-(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イル)-N-Me-アミノ	Cl	O	Cl
221	n-PrS	Cl	O	Cl
222	t-BuS	Me	O	Cl
223	5-MeO-Py-2-イルチオ	H	S	Br
224	シクロプロピルメチルチオ	Me	O	Cl
225	プロパルギルチオ	Me	O	Cl

【0033】

[0033]

【表 10】

[Table 10]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
226	MeON=C(Me)	H	NMe	Cl
227	EtON=C(Me)	H	NMe	Br
228	n-PrON=C(Me)	Me	O	Cl
229	i-PrON=C(Me)	Me	O	Cl
230	n-BuON=C(Me)	Me	O	Cl
231	i-BuON=C(Me)	Me	O	Cl
232	sec-BuON=C(Me)	Me	O	Cl
233	n-Pent-ON=C(Me)	Me	O	Cl
234	n-Hex-ON=C(Me)	Me	O	Cl
235	n- ⁷ Ph-ON=C(Me)	Me	O	Cl
236	c-PrCH ₂ N=C(Me)	Me	O	Cl
237	c-PentCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
238	t-BuCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
239	BnON=C(Me)	Me	O	Cl
240	4-Me-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
241	3-Me-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
242	2-Me-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
243	3,4-Me ₂ -BnON=C(Me)	Me	O	Cl
244	2,5-Me ₂ -BnON=C(Me)	Me	O	Cl
245	4-Cl-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
246	3-Cl-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
247	2-Cl-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
248	3,4-Cl ₂ -BnON=C(Me)	Me	O	Cl
249	HC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
250	H ₂ C=CHCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl

【0034】

[0034]

【表 11】

[Table 11]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
251	MeOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
252	EtOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
253	PhCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
254	Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
255	Ph(CH ₂) ₄ ON=C(Me)	Me	O	C1
256	PhOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
257	PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
258	4-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
259	2-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
260	4-Me-Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
261	2-Me-Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
262	4-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
263	2-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
264	4-Me-PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
265	2-Me-PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
266	PhCH(Me)ON=C(Me)	Me	O	C1
267	4-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)	Me	O	C1
268	2-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)	Me	O	C1
269	2-シアノ-PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
270	2-MeOC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
271	2-MeNHC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
272	2-Me ₂ NC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
273	PhCH(CN)ON=C(Me)	Me	O	C1
274	PhCH(COOMe)ON=C(Me)	Me	O	C1
275	PhCH(OMe)ON=C(Me)	Me	O	C1

【0035】

[0035]

【表 12】

[Table 12]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
276	IC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
277	MeC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
278	EtC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
279	n-PrC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
280	n-BuC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
281	t-BuC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
282	Me ₃ SiC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
283	PhC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
284	Et ₃ CC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
285	PhON=C(Me)	Me	O	C1
286	4-Me-PhON=C(Me)	Me	O	C1
287	3-Me-PhON=C(Me)	Me	O	C1
288	4-MeO-PhON=C(Me)	Me	O	C1
289	4-Me-PhON=C(Me)	Me	O	C1
290	2-Py-ON=C(Me)	Me	O	C1
291	5-CF ₃ -Py-2-ON=C(Me)	Me	O	C1
292	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-ON=C(Me)	Me	O	C1
293	3,4-Me ₂ -PhON=C(Me)	Me	O	C1
294	2,5-Me ₂ -PhON=C(Me)	Me	O	C1
295	BnON=CH	H	S	Br
296	PhON=CH	H	NMe	Br
297	Ph(CH ₃) ₂ ON=CH	H	NMe	Br
298	HC≡CCH ₂ ON=CH	H	O	Br
299	H ₂ C=CHCH ₂ ON=CH	H	O	Br
300	MeC≡CCH ₂ ON=CH	H	S	Br

【0036】

[0036]

【表 13】

[Table 13]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
301	MeSC(Me)=N	Me	O	Cl
302	EtSC(Me)=N	H	S	Br
303	n-PrSC(Me)=N	Me	O	Cl
304	n-BuSC(Me)=N	H	NMe	Cl
305	MeSC(Et)=N	H	NMe	Cl
306	MeSC(n-Pr)=N	Me	O	Cl
307	MeSC(n-Bu)=N	Cl	O	Br
308	MeSC(c-Pr)=N	Me	O	Cl
309	MeSC(c-Pent)=N	NMe	NMe	Br
310	MeSC(c-Hex)=N	Cl	O	Cl
311	BnSC(Me)=N	Me	O	Cl
312	BnSC(Et)=N	H	NMe	Cl
313	BnSC(n-Pr)=N	Cl	O	Cl
314	BnSC(n-Bu)=N	H	S	Br
315	BnSC(c-Pr)=N	Me	O	Cl
316	BnSC(t-Bu)=N	H	S	Cl
317	BnSC(c-Pent)=N	Cl	O	Br
318	BnSC(c-Hex)=N	H	O	Cl
319	BnSC(Ph)=N	Me	O	Cl
320	MeSC(Ph)=N	H	O	Br
321	EtSC(Ph)=N	Me	O	Cl
322	n-PrSC(Ph)=N	H	NMe	Cl
323	i-BuSC(Me)=N	Cl	O	Cl
324	sec-BuSC(Me)=N	H	S	Cl
325	Ph(CH ₂) ₂ SC(Me)=N	Me	O	Cl

【0037】

[0037]

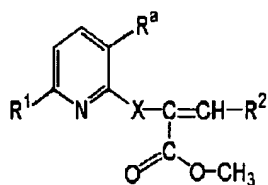
【表 14】

[Table 14]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
326	MeSC(SMe)=N	Me	O	Cl
327	EtSC(SMe)=N	H	NMe	Br
328	n-PrSC(SMe)=N	Me	O	Cl
329	n-BuSC(SMe)=N	H	NMe	Br
330	BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
331	<i>o</i> -PrCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
332	n-PrSC(S-n-Pr)=N	H	S	Br
333	n-PrSC(SEt)=N	Cl	O	Br
334	<i>o</i> -PentCH ₂ SC(SMe)=N	H	NMe	Cl
335	EtSC(SEt)=N	H	S	Br
336	n-BuSC(S-n-Bu)=N	H	S	Cl
337	HC≡CCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
338	H ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
339	Me ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
340	MeC≡CCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
341	Cl ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
342	2-Me-BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
343	4-Me-BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
344	MeOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
345	EtOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
346	i-PrOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
347	Me ₂ NC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
348	i-BuSC(SMe)=N	Me	O	Cl
349	sec-BuSC(SMe)=N	Me	O	Cl
350	BnSC(S-i-Bu)=N	Me	O	Cl

【0038】

[0038]



で示される化合物。

So compound . which is shown

【0039】

[0039]

【表 15】

[Table 15]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1001	Ph	H	NMe	Cl
1002	Ph	H	O	Cl
1003	Ph	H	S	Cl
1004	Ph	Me	O	Cl
1005	Ph	Et	O	Cl
1006	Ph	Cl	O	Cl
1007	Ph	Br	O	Cl
1008	4-Cl-Ph	Me	O	Cl
1009	3-Cl-Ph	Me	O	Cl
1010	2-Cl-Ph	Me	O	Cl
1011	4-Me-Ph	Me	O	Cl
1012	3-Me-Ph	Me	O	Cl
1013	2-Me-Ph	Me	O	Cl
1014	4-F-Ph	Me	O	Cl
1015	3-F-Ph	Me	O	Cl
1016	2-F-Ph	Me	O	Cl
1017	3, 4-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
1018	2, 4-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
1019	2, 6-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
1020	3, 4-Cl ₂ -Ph	Me	O	Cl
1021	Ph	H	NMe	Br
1022	Ph	H	S	Br
1023	Ph	H	O	Br
1024	Ph	Me	O	Br
1025	3-Me-Ph	Me	O	Br

【0040】

[0040]

【表 16】

[Table 16]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1026	Et ₃ CC≡C	H	NMe	Cl
1027	Et ₃ CC≡C	H	O	Cl
1028	Et ₃ CC≡C	H	S	Cl
1029	Et ₃ CC≡C	Me	O	Cl
1030	Me ₃ SiC≡C	H	NMe	Cl
1031	Me ₃ SiC≡C	H	O	Cl
1032	Me ₃ SiC≡C	H	S	Cl
1033	Me ₃ SiC≡C	Me	O	Cl
1034	Et ₃ SiC≡C	Me	O	Cl
1035	Me ₂ C(n-Bu)C≡C	Me	O	Cl
1036	c-Hex-C≡C	Me	O	Cl
1037	4-Cl-PhOC(Me) ₂ C≡C	Me	O	Cl
1038	PhOC(Me) ₂ C≡C	Me	O	Cl
1039	Me ₂ C(Bu)C≡C	Me	O	Cl
1040	Me ₂ C(Ph)C≡C	Me	O	Cl
1041	Et ₂ C(OEt)C≡C	Me	O	Cl
1042	Et ₂ C(Me)C≡C	Me	O	Cl
1043	Et ₃ CC≡C	Cl	O	Cl
1044	Me ₃ SiC≡C	Cl	O	Cl
1045	Et ₃ SiC≡C	Cl	O	Cl
1046	Et ₃ CC≡C	H	NMe	Br
1047	Et ₃ CC≡C	H	O	Br
1048	Et ₃ CC≡C	H	S	Br
1049	Et ₃ CC≡C	Me	O	Br
1050	Et ₃ CC≡C	Cl	O	Br

【0041】

[0041]

【表 17】

[Table 17]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1051	Me	H	NMe	Cl
1052	Et	H	O	Cl
1053	n-Pr	Me	O	Cl
1054	n-Bu	Me	O	Cl
1055	i-Bu	Cl	O	Cl
1056	sec-Bu	Cl	O	Cl
1057	n-Pent	H	NMe	Cl
1058	n-Hex	H	O	Cl
1059	n-ヘプチル	H	O	Cl
1060	n-オクチル	Me	O	Cl
1061	n-ノニル	H	NMe	Cl
1062	n-デシル	H	NMe	Cl
1063	t-Bu	H	NMe	Cl
1064	EtC(Me)	Me	O	Cl
1065	i-PrC(Me)	Me	O	Cl
1066	t-BuCH ₂	Me	O	Cl
1067	t-BuC(Me) ₂	H	NMe	Cl
1068	t-Bu(CH ₂) ₃	H	NMe	Cl
1069	t-BuC(Me) ₂ CH ₂	H	NMe	Cl
1070	t-Bu(CH ₂) ₃	H	NMe	Cl
1071	n-Pr	H	NMe	Br
1072	sec-Bu	H	O	Br
1073	EtC(Me)	H	O	Br
1074	t-Bu	Me	O	Br
1075	t-BuCH ₂	Me	O	Br

【0042】

[0042]

【表 18】

[Table 18]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1076	H ₂ C=CH	H	NMe	Cl
1077	MeCH=CH	H	O	Cl
1078	EtCH=CH	H	S	Cl
1079	n-PrCH=CH	Cl	O	Cl
1080	n-BuCH=CH	Me	O	Cl
1081	n-PentCH=CH	Cl	O	Cl
1082	n-HexCH=CH	Br	O	Cl
1083	n-ヘプチル-CH=CH	H	O	Cl
1084	n-オクチル-CH=CH	H	O	Cl
1085	Me ₂ C=CH	Cl	S	Cl
1086	Me ₂ C=C (Me)	Me	O	Br
1087	MeCH=C (Me)	Me	O	Cl
1088	Cl ₂ C=CH	Cl	O	Cl
1089	Cl ₂ C=C (Me)	Me	O	Cl
1090	Cl ₂ C=C (Cl)	H	O	Cl
1091	PhCH ₂ CH=CH	H	O	Cl
1092	PhCH ₂ CH=C (Me)	H	S	Cl
1093	PhCH ₂ C(Me)=C(Me)	H	NMe	Cl
1094	MeOCH=CH	H	O	Cl
1095	EtOCH=CH	H	O	Cl
1096	n-PrOCH=CH	Me	O	Cl
1097	n-BuOCH=CH	H	O	Cl
1098	i-PrOCH=CH	H	O	Cl
1099	t-BuOCH=CH	H	O	Cl
1100	PhOCH=CH	H	O	Cl

【0043】

[0043]

【表 19】

[Table 19]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1101	MeOCH=C (Me)	Me	O	Cl
1102	EtOCH=C (Me)	H	NMe	Cl
1103	n-PrOCH=C (Me)	H	S	Cl
1104	n-BuOCH=C (Me)	H	O	Br
1105	i-PrOCH=C (Me)	H	O	Cl
1106	t-BuOCH=C (Me)	H	O	Cl
1107	PhOCH=C (Me)	Cl	O	Cl
1108	MeOC(Me)=C(Me)	H	NMe	Cl
1109	EtOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
1110	n-PrOC(Me)=C(Me)	H	O	Cl
1111	n-BuOC(Me)=C(Me)	Me	O	Cl
1112	i-PrOC(Me)=C(Me)	H	O	Cl
1113	t-BuOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
1114	PhOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
1115	MeOC(O)CH=CH	Me	O	Cl
1116	MeOC(O)C(Me)=CH	H	O	Br
1117	MeOC(O)CH=C(Me)	Me	O	Cl
1118	MeOC(O)C(Me)=C(Me)	Cl	O	Cl
1119	MeOC(O)C(Cl)=C(Me)	Cl	O	Cl
1120	MeOC(O)C(Br)=C(Me)	H	NMe	Cl
1121	MeOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	Cl
1122	EtOC(O)CH=C(Me)	H	O	Cl
1123	EtOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	Cl
1124	EtOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	Cl
1125	i-PrOC(O)CH=C(Me)	Me	O	Cl

【0044】

[0044]

【表 20】

[Table 20]

番号	R ¹	R ²	X	R ²
1126	i-PrOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	C 1
1127	i-PrOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	C 1
1128	t-BuOC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
1129	t-BuOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	C 1
1130	t-BuOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	C 1
1131	MeOC(O)C(CO ₂ Me)=C(Me)	H	O	C 1
1132	MeOC(O)C(CN)=C(Me)	Me	O	C 1
1133	EtOC(O)C(CO ₂ Et)=C(Me)	C 1	O	C 1
1134	MeOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
1135	EtOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
1136	PhCH=C(Me)	Me	O	C 1
1137	BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
1138	4-Me-BnOCH=C(Me)	H	O	C 1
1139	3-Me-BnOCH=C(Me)	H	O	C 1
1140	2-Me-BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
1141	3,4-Me ₂ -BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
1142	PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
1143	4-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
1144	3-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
1145	2-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
1146	2,5-Me ₂ -PhOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
1147	3,4-Me ₂ -PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
1148	Me ₂ NC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
1149	(n-Bu) ₂ NC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
1150	Me ₂ NC(O)OCH=C(Me)	Me	O	C 1

【0045】

[0045]

【表 21】

[Table 21]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1151	1-シクロヘキセニル	Me	O	Cl
1152	Py-2-イル	H	NMe	Cl
1153	Py-3-イル	H	NMe	Cl
1154	Py-4-イル	H	S	Cl
1155	6-Cl-Py-2-イル	Me	O	Cl
1156	6-Cl-Py-3-イル	Me	O	Cl
1157	2,6-Cl ₂ -Py-3-イル	H	S	Cl
1158	2-チエニル	Me	O	Cl
1159	3-チエニル	H	NMe	Br
1160	2-フリル	Cl	O	Cl
1161	3-フリル	Cl	O	Br
1162	2-ベンゾチエニル	H	S	Cl
1163	3-ベンゾチエニル	H	NMe	Cl
1164	5-MeO-2-Py	Me	O	Cl
1165	ピロール-1-イル	H	S	Cl
1166	2-ピリミジニル	H	S	Cl
1167	4-ピリミジニル	Cl	O	Cl
1168	1-ピラゾリル	Cl	O	Cl
1169	5-チアゾリル	H	NMe	Cl
1170	5-オキサゾリル	H	NMe	Cl
1171	1-インドリル	Me	O	Cl
1172	2-キノリニル	Me	O	Cl
1173	3-ピリダジニル	H	S	Cl
1174	ピリジン-2-オン-1-イル	Me	O	Cl
1175	ピリジン-3-オン-1-イル	Me	O	Cl

【0046】

[0046]

【表 22】

[Table 22]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
1176	PhO	H	NMe	Br
1177	4-Me-PhO	Me	O	Cl
1178	3-Me-PhO	H	NMe	Br
1179	2-Me-PhO	Me	O	Cl
1180	3, 4-Me-PhO	Me	O	Cl
1181	2, 5-Me-PhO	H	S	Br
1182	4-Cl-PhO	H	S	Br
1183	2-PyO	Me	O	Cl
1184	5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ	Me	O	Cl
1185	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ	Me	O	Cl
1186	4-CF ₃ -PhO	Me	O	Cl
1187	ピリミジン-4-イルオキシ	Cl	O	Cl
1188	6-Cl-ピリミジン-4-イルオキシ	Me	O	Cl
1189	2-シアノ-PhO	Me	O	Cl
1190	ピリミジン-2-イルオキシ	H	S	Br
1191	Py-2-イルオキシ	H	NMe	Br
1192	5-Py-2-イルオキシ	H	NMe	Cl
1193	2-ニトロ-PhO	H	NMe	Br
1194	BnO	Me	O	Cl
1195	4-Me-BnO	Me	O	Cl
1196	アリルオキシ	Me	O	Cl
1197	プロパルギルオキシ	Me	O	Cl
1198	シクロプロピルメチルオキシ	Me	O	Cl
1199	i-PrO	H	NMe	Br
1200	t-BuO	Cl	O	Cl

【0047】

[0047]

【表 23】

[Table 23]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1201	PhNH	H	NMe	Br
1202	5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ	H	S	Cl
1203	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ	H	NMe	Cl
1204	PhS	Me	O	Cl
1205	4-Me-PhS	Me	O	Cl
1206	3-Me-PhS	Me	O	Cl
1207	2-Me-PhS	Me	O	Cl
1208	3, 4-Me ₂ -PhS	Me	O	Cl
1209	BnS	Me	O	Cl
1210	4-Me-BnS	Me	O	Cl
1211	3-Me-BnS	Me	O	Cl
1212	2-Me-BnS	Me	O	Cl
1213	3, 4-Me ₂ -BnS	Me	O	Br
1214	Py-2-イルチオ	H	S	Cl
1215	5-CF ₃ -Py-2-イルチオ	Me	O	Cl
1216	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルチオ	Me	O	Cl
1217	ピリミジン-4-イルチオ	H	S	Cl
1218	ピリミジン-2-イルチオ	H	NMe	Cl
1219	N-(5-CF ₃ -Py-2-イル)-N-Me-アミノ	Me	O	Cl
1220	N-(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イル)-N-Me-アミノ	Cl	O	Cl
1221	n-PrS	Cl	O	Cl
1222	t-BuS	Me	O	Cl
1223	5-MeO-Py-2-イルチオ	H	S	Br
1224	シクロプロピルメチルチオ	Me	O	Cl
1225	プロパルギルチオ	Me	O	Cl

【0048】

[0048]

【表 24】

[Table 24]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1226	MeON=C(Me)	H	NMe	Cl
1227	EtON=C(Me)	H	NMe	Br
1228	n-PrON=C(Me)	Me	O	Cl
1229	i-PrON=C(Me)	Me	O	Cl
1230	n-BuON=C(Me)	Me	O	Cl
1231	i-BuON=C(Me)	Me	O	Cl
1232	sec-BuON=C(Me)	Me	O	Cl
1233	n-Pent·ON=C(Me)	Me	O	Cl
1234	n-Hex·ON=C(Me)	Me	O	Cl
1235	n-oct·ON=C(Me)	Me	O	Cl
1236	n-PrCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
1237	n-PentCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
1238	t-BuCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
1239	BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1240	4-Me·BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1241	3-Me·BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1242	2-Me·BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1243	3,4-Me ₂ ·BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1244	2,5-Me ₂ ·BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1245	4-Cl·BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1246	3-Cl·BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1247	2-Cl·BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1248	3,4-Cl ₂ ·BnON=C(Me)	Me	O	Cl
1249	HC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
1250	H ₂ C=CHCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl

【0049】

[0049]

【表 25】

[Table 25]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
1251	MeOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1252	EtOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1253	PhCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1254	Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1255	Ph(CH ₂) ₄ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1256	PhOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1257	PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1258	4-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1259	2-Me-Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1260	4-Me-Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1261	2-Me-Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1262	4-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1263	2-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1264	4-Me-PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1265	2-Me-PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1266	PhCH(Me)ON=C(Me)	Me	O	C 1
1267	4-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)	Me	O	C 1
1268	2-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)	Me	O	C 1
1269	2-シアノ-PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1270	2-MeOC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1271	2-MeNHC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1272	2-Me ₂ NC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C 1
1273	PhCH(CN)ON=C(Me)	Me	O	C 1
1274	PhCH(COOMe)ON=C(Me)	Me	O	C 1
1275	PhCH(OMe)ON=C(Me)	Me	O	C 1

【0050】

[0050]

【表 26】

[Table 26]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1276	$\text{IC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1277	$\text{MeC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1278	$\text{EtC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1279	$\text{n-PrC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1280	$\text{n-BuC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1281	$\text{t-BuC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1282	$\text{Me}_3\text{SiC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1283	$\text{PhC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1284	$\text{Et}_3\text{CC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1285	$\text{PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1286	$4\text{-Me-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1287	$3\text{-Me-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1288	$4\text{-MeO-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1289	$4\text{-Me-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1290	$2\text{-Py-ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1291	$5\text{-CF}_3\text{-Py-2-ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1292	$3\text{-Cl-5-CF}_3\text{-Py-2-ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1293	$3,4\text{-Me}_2\text{-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1294	$2,5\text{-Me}_2\text{-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	Cl
1295	$\text{BnON}=\text{CH}$	H	S	Br
1296	$\text{PhON}=\text{CH}$	H	NMe	Br
1297	$\text{Ph}(\text{CH})_2\text{ON}=\text{CH}$	H	NMe	Br
1228	$\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{CH}$	H	O	Br
1299	$\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{ON}=\text{CH}$	H	O	Br
1800	$\text{MeC}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}=\text{CH}$	H	S	Br

【0051】

[0051]

【表 27】

[Table 27]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
1301	Me SC (Me) =N	Me	O	Cl
1302	Et SC (Me) =N	H	S	Br
1303	n-Pr SC (Me) =N	Me	O	Cl
1304	n-Bu SC (Me) =N	H	NMe	Cl
1305	Me SC (Et) =N	H	NMe	Cl
1306	Me SC (n-Pr) =N	Me	O	Cl
1307	Me SC (n-Bu) =N	Cl	O	Br
1308	Me SC (c-Pr) =N	Me	O	Cl
1309	MeSC(c-Pent)=N	NMe	NMe	Br
1310	Me SC (c-Hex) =N	Cl	O	Cl
1311	Bn SC (Me) =N	Me	O	Cl
1312	Bn SC (Et) =N	H	NMe	Cl
1313	Bn SC (n-Pr) =N	Cl	O	Cl
1314	Bn SC (n-Bu) =N	H	S	Br
1315	Bn SC (c-Pr) =N	Me	O	Cl
1316	Bn SC (t-Bu) =N	H	S	Cl
1317	Bn SC (c-Pent) =N	Cl	O	Br
1318	Bn SC (c-Hex) =N	H	O	Cl
1319	Bn SC (Ph) =N	Me	O	Cl
1320	Me SC (Ph) =N	H	O	Br
1321	Et SC (Ph) =N	Me	O	Cl
1322	n-Pr SC (Ph) =N	H	NMe	Cl
1323	i-Bu SC (Me) =N	Cl	O	Cl
1324	sec-Bu SC (Me) =N	H	S	Cl
1325	Ph(CH ₂) ₂ SC(Me)=N	Me	O	Cl

【0052】

[0052]

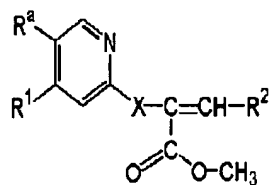
【表 28】

[Table 28]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
1326	MeSC(SMe)=N	Me	O	Cl
1327	EtSC(SMe)=N	H	NMe	Br
1328	n-PrSC(SMe)=N	Me	O	Cl
1329	n-BuSC(SMe)=N	H	NMe	Br
1330	BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
1331	c-PrCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1332	n-PrSC(S-n-Pr)=N	H	S	Br
1333	n-PrSC(SEt)=N	Cl	O	Br
1334	c-PentCH ₂ SC(SMe)=N	H	NMe	Cl
1335	EtSC(SEt)=N	H	S	Br
1336	n-BuSC(S-n-Bu)=N	H	S	Cl
1337	HC≡CCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1338	H ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1339	Me ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1340	MeC≡CCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1341	Cl ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1342	2-Me-BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
1343	4-Me-BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
1344	MeOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1345	EtOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1346	i-PrOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1347	Me ₂ NC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
1348	i-BuSC(SMe)=N	Me	O	Cl
1349	sec-BuSC(SMe)=N	Me	O	Cl
1350	BnSC(S-i-Bu)=N	Me	O	Cl

【0053】

[0053]



で示される化合物。

So compound . which is shown

【0054】

[0054]

【表 29】

[Table 29]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2001	Ph	H	NMe	Cl
2002	Ph	H	O	Cl
2003	Ph	H	S	Cl
2004	Ph	Me	O	Cl
2005	Ph	Et	O	Cl
2006	Ph	Cl	O	Cl
2007	Ph	Br	O	Cl
2008	4-Cl-Ph	Me	O	Cl
2009	3-Cl-Ph	Me	O	Cl
2010	2-Cl-Ph	Me	O	Cl
2011	4-Me-Ph	Me	O	Cl
2012	3-Me-Ph	Me	O	Cl
2013	2-Me-Ph	Me	O	Cl
2014	4-F-Ph	Me	O	Cl
2015	3-F-Ph	Me	O	Cl
2016	2-F-Ph	Me	O	Cl
2017	3, 4-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
2018	2, 4-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
2019	2, 6-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
2020	3, 4-Cl ₂ -Ph	Me	O	Cl
2021	Ph	H	NMe	Br
2022	Ph	H	S	Br
2023	Ph	H	O	Br
2024	Ph	Me	O	Br
2025	3-Me-Ph	Me	O	Br

【0055】

[0055]

【表 30】

[Table 30]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
2026	Et ₃ CC≡C	H	NMe	Cl
2027	Et ₃ CC≡C	H	O	Cl
2028	Et ₃ CC≡C	H	S	Cl
2029	Et ₃ CC≡C	Me	O	Cl
2030	Me ₃ SiC≡C	H	NMe	Cl
2031	Me ₃ SiC≡C	H	O	Cl
2032	Me ₃ SiC≡C	H	S	Cl
2033	Me ₃ SiC≡C	Me	O	Cl
2034	Et ₃ SiC≡C	Me	O	Cl
2035	Me ₂ C(n-Bu)C≡C	Me	O	Cl
2036	c-Hex-C≡C	Me	O	Cl
2037	4-Cl-PhOC(Me) ₂ C≡C	Me	O	Cl
2038	PhOC(Me) ₂ C≡C	Me	O	Cl
2039	Me ₂ C(Bu)C≡C	Me	O	Cl
2040	Me ₂ C(Ph)C≡C	Me	O	Cl
2041	Et ₂ C(OEt)C≡C	Me	O	Cl
2042	Et ₂ C(Me)C≡C	Me	O	Cl
2043	Et ₃ CC≡C	Cl	O	Cl
2044	Me ₃ SiC≡C	Cl	O	Cl
2045	Et ₃ SiC≡C	Cl	O	Cl
2046	Et ₃ CC≡C	H	NMe	Br
2047	Et ₃ CC≡C	H	O	Br
2048	Et ₃ CC≡C	H	S	Br
2049	Et ₃ CC≡C	Me	O	Br
2050	Et ₃ CC≡C	Cl	O	Br

【0056】

[0056]

【表 31】

[Table 31]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2051	Me	H	NMe	Cl
2052	Et	H	O	Cl
2053	n-Pr	Me	O	Cl
2054	n-Bu	Me	O	Cl
2055	i-Bu	Cl	O	Cl
2056	sec-Bu	Cl	O	Cl
2057	n-Pent	H	NMe	Cl
2058	n-Hex	H	O	Cl
2059	n-ヘプチル	H	O	Cl
2060	n-オクチル	Me	O	Cl
2061	n-ノニル	H	NMe	Cl
2062	n-デシル	H	NMe	Cl
2063	t-Bu	H	NMe	Cl
2064	EtC(Me)	Me	O	Cl
2065	i-PrC(Me)	Me	O	Cl
2066	t-BuCH ₂	Me	O	Cl
2067	t-BuC(Me) ₂	H	NMe	Cl
2068	t-Bu(CH ₂) ₂	H	NMe	Cl
2069	t-BuC(Me) ₂ CH ₂	H	NMe	Cl
2070	t-Bu(CH ₂) ₃	H	NMe	Cl
2071	n-Pr	H	NMe	Br
2072	sec-Bu	H	O	Br
2073	EtC(Me)	H	O	Br
2074	t-Bu	Me	O	Br
2075	t-BuCH ₂	Me	O	Br

【0057】

[0057]

【表 32】

[Table 32]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2076	H ₂ C=CH	H	NMe	Cl
2077	MeCH=CH	H	O	Cl
2078	EtCH=CH	H	S	Cl
2079	n-PrCH=CH	Cl	O	Cl
2080	n-BuCH=CH	Me	O	Cl
2081	n-PentCH=CH	Cl	O	Cl
2082	n-HexCH=CH	Br	O	Cl
2083	n-ヘプチル-CH=CH	H	O	Cl
2084	n-オクチル-CH=CH	H	O	Cl
2085	Me ₂ C=CH	Cl	S	Cl
2086	Me ₂ C=C (Me)	Me	O	Br
2087	MeCH=C (Me)	Me	O	Cl
2088	Cl ₂ C=CH	Cl	O	Cl
2089	Cl ₂ C=C (Me)	Me	O	Cl
2090	Cl ₂ C=C (Cl)	H	O	Cl
2091	PhCH ₂ CH=CH	H	O	Cl
2092	PhCH ₂ CH=C (Me)	H	S	Cl
2093	PhCH ₂ C(Me)=C(Me)	H	NMe	Cl
2094	MeOCH=CH	H	O	Cl
2095	EtOCH=CH	H	O	Cl
2096	n-PrOCH=CH	Me	O	Cl
2097	n-BuOCH=CH	H	O	Cl
2098	i-PrOCH=CH	H	O	Cl
2099	t-BuOCH=CH	H	O	Cl
2100	PhOCH=CH	H	O	Cl

【0058】

[0058]

【表 33】

[Table 33]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2101	MeOCH=C (Me)	Me	O	Cl
2102	EtOCH=C (Me)	H	NMe	Cl
2103	n-PrOCH=C (Me)	H	S	Cl
2104	n-BuOCH=C (Me)	H	O	Br
2105	i-PrOCH=C (Me)	H	O	Cl
2106	t-BuOCH=C (Me)	H	O	Cl
2107	PhOCH=C (Me)	Cl	O	Cl
2108	MeOC(Me)=C(Me)	H	NMe	Cl
2109	EtOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
2110	n-PrOC(Me)=C(Me)	H	O	Cl
2111	n-BuOC(Me)=C(Me)	Me	O	Cl
2112	i-PrOC(Me)=C(Me)	H	O	Cl
2113	t-BuOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
2114	PhOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
2115	MeOC(O)CH=CH	Me	O	Cl
2116	MeOC(O)C(Me)=CH	H	O	Br
2117	MeOC(O)CH=C(Me)	Me	O	Cl
2118	MeOC(O)C(Me)=C(Me)	Cl	O	Cl
2119	MeOC(O)C(Cl)=C(Me)	Cl	O	Cl
2120	MeOC(O)C(Br)=C(Me)	H	NMe	Cl
2121	MeOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	Cl
2122	EtOC(O)CH=C(Me)	H	O	Cl
2123	EtOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	Cl
2124	EtOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	Cl
2125	i-PrOC(O)CH=C(Me)	Me	O	Cl

【0059】

[0059]

【表 34】

[Table 34]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
2126	i-PrOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	C 1
2127	i-PrOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	C 1
2128	t-BuOC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
2129	t-BuOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	C 1
2130	t-BuOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	C 1
2131	MeOC(O)C(CO ₂ Me)=C(Me)	H	O	C 1
2132	MeOC(O)C(CN)=C(Me)	Me	O	C 1
2133	EtOC(O)C(CO ₂ Et)=C(Me)	C 1	O	C 1
2134	MeOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
2135	EtOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
2136	PhCH=C(Me)	Me	O	C 1
2137	BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
2138	4-Me-BnOCH=C(Me)	H	O	C 1
2139	3-Me-BnOCH=C(Me)	H	O	C 1
2140	2-Me-BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
2141	3,4-Me ₂ -BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
2142	PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
2143	4-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
2144	3-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
2145	2-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
2146	2,5-Me ₂ -PhOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
2147	3,4-Me ₂ -PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
2148	Me ₂ NC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
2149	(n-Bu) ₂ NC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
2150	Me ₂ NC(O)OCH=C(Me)	Me	O	C 1

【0060】

[0060]

【表 35】

[Table 35]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2151	1-シクロヘキセニル	Me	O	Cl
2152	Py-2-イル	H	NMe	Cl
2153	Py-3-イル	H	NMe	Cl
2154	Py-4-イル	H	S	Cl
2155	6-Cl-Py-2-イル	Me	O	Cl
2156	6-Cl-Py-3-イル	Me	O	Cl
2157	2,6-Cl ₂ -Py-3-イル	H	S	Cl
2158	2-チエニル	Me	O	Cl
2159	3-チエニル	H	NMe	Br
2160	2-フリル	Cl	O	Cl
2161	3-フリル	Cl	O	Br
2162	2-ベンゾチエニル	H	S	Cl
2163	3-ベンゾチエニル	H	NMe	Cl
2164	5-MeO-2-Py	Me	O	Cl
2165	ピロール-1-イル	H	S	Cl
2166	2-ピリミジニル	H	S	Cl
2167	4-ピリミジニル	Cl	O	Cl
2168	1-ピラゾリル	Cl	O	Cl
2169	5-チアゾリル	H	NMe	Cl
2170	5-オキサゾリル	H	NMe	Cl
2171	1-インドリル	Me	O	Cl
2172	2-キノリニル	Me	O	Cl
2173	3-ピリダジニル	H	S	Cl
2174	ピリジン-2-オン-1-イル	Me	O	Cl
2175	ピリジン-3-オン-1-イル	Me	O	Cl

【0061】

[0061]

【表 36】

[Table 36]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2176	PhO	H	NMe	Br
2177	4-Me-PhO	Me	O	Cl
2178	3-Me-PhO	H	NMe	Br
2179	2-Me-PhO	Me	O	Cl
2180	3, 4-Me-PhO	Me	O	Cl
2181	2, 5-Me-PhO	H	S	Br
2182	4-Cl-PhO	H	S	Br
2183	2-PyO	Me	O	Cl
2184	5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ	Me	O	Cl
2185	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ	Me	O	Cl
2186	4-CF ₃ -PhO	Me	O	Cl
2187	ピリミジン-4-イルオキシ	Cl	O	Cl
2188	6-Cl-ピリミジン-4-イルオキシ	Me	O	Cl
2189	2-シアノ-PhO	Me	O	Cl
2190	ピリミジン-2-イルオキシ	H	S	Br
2191	Py-2-イルオキシ	H	NMe	Br
2192	5-Py-2-イルオキシ	H	NMe	Cl
2193	2-ニトロ-PhO	H	NMe	Br
2194	BnO	Me	O	Cl
2195	4-Me-BnO	Me	O	Cl
2196	アリルオキシ	Me	O	Cl
2197	プロパルギルオキシ	Me	O	Cl
2198	シクロプロピルメチルオキシ	Me	O	Cl
2199	i-PrO	H	NMe	Br
2200	t-BuO	Cl	O	Cl

【0062】

[0062]

【表 37】

[Table 37]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2201	PhNH	H	NMe	Br
2202	5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ	H	S	Cl
2203	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ	H	NMe	Cl
2204	PhS	Me	O	Cl
2205	4-Me-PhS	Me	O	Cl
2206	3-Me-PhS	Me	O	Cl
2207	2-Me-PhS	Me	O	Cl
2208	3, 4-Me ₂ -PhS	Me	O	Cl
2209	BnS	Me	O	Cl
2210	4-Me-BnS	Me	O	Cl
2211	3-Me-BnS	Me	O	Cl
2212	2-Me-BnS	Me	O	Cl
2213	3, 4-Me ₂ -BnS	Me	O	Br
2214	Py-2-イルチオ	H	S	Cl
2215	5-CF ₃ -Py-2-イルチオ	Me	O	Cl
2216	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルチオ	Me	O	Cl
2217	ピリミジン-4-イルチオ	H	S	Cl
2218	ピリミジン-2-イルチオ	H	NMe	Cl
2219	N-(5-CF ₃ -Py-2-イル)-N-Me-7ミ	Me	O	Cl
2220	N-(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イル)-N-Me-7ミ	Cl	O	Cl
2221	n-PrS	Cl	O	Cl
2222	t-BuS	Me	O	Cl
2223	5-MeO-Py-2-イルチオ	H	S	Br
2224	シクロプロピルメチルチオ	Me	O	Cl
2225	プロパルギルチオ	Me	O	Cl

【0063】

[0063]

【表 38】

[Table 38]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2226	MeON=C(Me)	H	S	Cl
2227	EtON=C(Me)	H	NMe	Br
2228	n-PrON=C(Me)	H	O	Cl
2229	i-PrON=C(Me)	H	S	Cl
2230	n-BuON=C(Me)	H	O	Cl
2231	i-BuON=C(Me)	H	S	Cl
2232	sec-BuON=C(Me)	H	O	Cl
2233	n-PentON=C(Me)	H	S	Cl
2234	n-HexON=C(Me)	H	O	Cl
2235	n-octON=C(Me)	H	NMe	Cl
2236	c-PrCH ₂ ON=C(Me)	H	O	Cl
2237	c-PentCH ₂ ON=C(Me)	H	S	Cl
2238	t-BuCH ₂ ON=C(Me)	H	S	Cl
2239	BnON=C(Me)	H	NMe	Cl
2240	4-Me-BnON=C(Me)	H	O	Cl
2241	3-Me-BnON=C(Me)	H	NMe	Cl
2242	2-Me-BnON=C(Me)	H	O	Cl
2243	3,4-Me ₂ -BnON=C(Me)	H	NMe	Cl
2244	2,5-Me ₂ -BnON=C(Me)	H	O	Cl
2245	4-Cl-BnON=C(Me)	H	S	Cl
2246	3-Cl-BnON=C(Me)	H	O	Cl
2247	2-Cl-BnON=C(Me)	H	NMe	Cl
2248	3,4-Cl ₂ -BnON=C(Me)	H	O	Cl
2249	HC≡CCH ₂ ON=C(Me)	H	NMe	Cl
2250	H ₂ C=CHCH ₂ ON=C(Me)	H	O	Cl

【0064】

[0064]

【表 39】

[Table 39]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
2251	MeOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	H	S	C 1
2252	EtOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	H	O	C 1
2253	PhCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	H	NMe	C 1
2254	Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	H	O	C 1
2255	Ph(CH ₂) ₄ ON=C(Me)	H	NMe	C 1
2256	PhOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	H	S	C 1
2257	PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	H	NMe	C 1
2258	4-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	H	O	C 1
2259	2-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	H	NMe	C 1
2260	4-Me-Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	H	O	C 1
2261	2-Me-Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	H	NMe	C 1
2262	4-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	H	S	C 1
2263	2-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	H	NMe	C 1
2264	4-Me-PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	H	O	C 1
2265	2-Me-PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	H	NMe	C 1
2266	PhCH(Me)ON=C(Me)	H	O	C 1
2267	4-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)	H	S	C 1
2268	2-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)	H	O	C 1
2269	2-シアノ-PhCH ₂ ON=C(Me)	H	NMe	C 1
2270	2-MeOC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	H	S	C 1
2271	2-MeNHC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	H	NMe	C 1
2272	2-Me ₂ NC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	H	O	C 1
2273	PhCH(CN)ON=C(Me)	H	S	C 1
2274	PhCH(COOMe)ON=C(Me)	H	O	C 1
2275	PhCH(OMe)ON=C(Me)	H	NMe	C 1

【0065】

[0065]

【表 40】

[Table 40]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2276	$\text{IC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	O	C 1
2277	$\text{MeC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	NMe	C 1
2278	$\text{EtC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	O	C 1
2279	$\text{n-PrC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	S	C 1
2280	$\text{n-BuC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	O	C 1
2281	$\text{t-BuC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	NMe	C 1
2282	$\text{Me}_3\text{SiC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	O	C 1
2283	$\text{PhC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	S	C 1
2284	$\text{Et}_3\text{CC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	O	C 1
2285	$\text{PhON}=\text{C}(\text{Me})$	H	NMe	C 1
2286	$4\text{-Me-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	H	O	C 1
2287	$3\text{-Me-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	H	NMe	C 1
2288	$4\text{-MeO-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	H	S	C 1
2289	$4\text{-Me-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	H	NMe	C 1
2290	$2\text{-Py-ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	O	C 1
2291	$5\text{-CF}_3\text{-Py-2-ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	NMe	C 1
2292	$3\text{-Cl-5-CF}_3\text{-Py-2-ON}=\text{C}(\text{Me})$	H	O	C 1
2293	$3,4\text{-Me}_2\text{-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	H	NMe	C 1
2294	$2,5\text{-Me}_2\text{-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	H	O	C 1
2295	$\text{BnON}=\text{CH}$	H	S	Br
2296	$\text{PhON}=\text{CH}$	H	NMe	Br
2297	$\text{Ph}(\text{CH})_2\text{ON}=\text{CH}$	H	NMe	Br
2228	$\text{HC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{CH}$	H	O	Br
2299	$\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2 \text{ON}=\text{CH}$	H	O	Br
2300	$\text{MeC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{CH}$	H	S	Br

【0066】

[0066]

【表 41】

[Table 41]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
2301	Me SC (Me) =N	Me	O	Cl
2302	Et SC (Me) =N	H	S	Br
2303	n-Pr SC (Me) =N	Me	O	Cl
2304	n-Bu SC (Me) =N	H	NMe	Cl
2305	Me SC (Et) =N	H	NMe	Cl
2306	Me SC (n-Pr) =N	Me	O	Cl
2307	Me SC (n-Bu) =N	Cl	O	Br
2308	Me SC (c-Pr) =N	Me	O	Cl
2309	MeSC(c-Pent)=N	NMe	NMe	Br
2310	Me SC (c-Hex) =N	Cl	O	Cl
2311	Bn SC (Me) =N	Me	O	Cl
2312	Bn SC (Et) =N	H	NMe	Cl
2313	Bn SC (n-Pr) =N	Cl	O	Cl
2314	Bn SC (n-Bu) =N	H	S	Br
2315	Bn SC (c-Pr) =N	Me	O	Cl
2316	Bn SC (t-Bu) =N	H	S	Cl
2317	Bn SC (c-Pent) =N	Cl	O	Br
2318	Bn SC (c-Hex) =N	H	O	Cl
2319	Bn SC (Ph) =N	Me	O	Cl
2320	Me SC (Ph) =N	H	O	Br
2321	Et SC (Ph) =N	Me	O	Cl
2322	n-Pr SC (Ph) =N	H	NMe	Cl
2323	i-Bu SC (Me) =N	Cl	O	Cl
2324	sec-Bu SC (Me) =N	H	S	Cl
2325	Ph(CH ₂) ₂ SC(Me)=N	Me	O	Cl

【0067】

[0067]

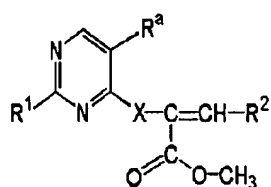
【表 42】

[Table 42]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
2326	MeSC(SMe)=N	Me	O	Cl
2327	EtSC(SMe)=N	H	NMe	Br
2328	n-PrSC(SMe)=N	Me	O	Cl
2329	n-BuSC(SMe)=N	H	NMe	Br
2330	BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
2331	c-PrCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2332	n-PrSC(S-n-Pr)=N	H	S	Br
2333	n-PrSC(SEt)=N	Cl	O	Br
2334	c-PentCH ₂ SC(SMe)=N	H	NMe	Cl
2335	EtSC(SEt)=N	H	S	Br
2336	n-BuSC(S-n-Bu)=N	H	S	Cl
2337	HC≡CCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2338	H ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2339	Me ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2340	MeC≡CCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2341	Cl ₃ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2342	2-Me-BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
2343	4-Me-BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
2344	MeOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2345	EtOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2346	i-PrOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2347	Me ₂ NC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
2348	i-BuSC(SMe)=N	Me	O	Cl
2349	sec-BuSC(SMe)=N	Me	O	Cl
2350	BnSC(S-i-Bu)=N	Me	O	Cl

【0068】

[0068]



で示される化合物。

So compound . which is shown

【0069】

[0069]

【表 43】

[Table 43]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
3001	Ph	H	NMe	Cl
3002	Ph	H	O	Cl
3003	Ph	H	S	Cl
3004	Ph	Me	O	Cl
3005	Ph	Et	O	Cl
3006	Ph	Cl	O	Cl
3007	Ph	Br	O	Cl
3008	4-Cl-Ph	Me	O	Cl
3009	3-Cl-Ph	Me	O	Cl
3010	2-Cl-Ph	Me	O	Cl
3011	4-Me-Ph	Me	O	Cl
3012	3-Me-Ph	Me	O	Cl
3013	2-Me-Ph	Me	O	Cl
3014	4-F-Ph	Me	O	Cl
3015	3-F-Ph	Me	O	Cl
3016	2-F-Ph	Me	O	Cl
3017	3, 4-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
3018	2, 4-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
3019	2, 6-Me ₂ -Ph	Me	O	Cl
3020	3, 4-Cl ₂ -Ph	Me	O	Cl
3021	Ph	H	NMe	Br
3022	Ph	H	S	Br
3023	Ph	H	O	Br
3024	Ph	Me	O	Br
3025	3-Me-Ph	Me	O	Br

【0070】

[0070]

【表 44】

[Table 44]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
3001	Et ₃ CC≡C	H	NMe	Cl
3002	Et ₃ CC≡C	H	O	Cl
3003	Et ₃ CC≡C	H	S	Cl
3004	Et ₃ CC≡C	Me	O	Cl
3005	Me ₃ SiC≡C	H	NMe	Cl
3006	Me ₃ SiC≡C	H	O	Cl
3007	Me ₃ SiC≡C	H	S	Cl
3008	Me ₃ SiC≡C	Me	O	Cl
3009	Et ₃ SiC≡C	Me	O	Cl
3010	Me ₂ C(n-Bu)C≡C	Me	O	Cl
3011	c-Hex-C≡C	Me	O	Cl
3012	4-Cl-PhOC(Me) ₂ C≡C	Me	O	Cl
3013	PhOC(Me) ₂ C≡C	Me	O	Cl
3014	Me ₂ C(Bu)C≡C	Me	O	Cl
3015	Me ₂ C(Ph)C≡C	Me	O	Cl
3016	Et ₂ C(OEt)C≡C	Me	O	Cl
3017	Et ₂ C(Me)C≡C	Me	O	Cl
3018	Et ₃ CC≡C	Cl	O	Cl
3019	Me ₃ SiC≡C	Cl	O	Cl
3020	Et ₃ SiC≡C	Cl	O	Cl
3021	Et ₃ CC≡C	H	NMe	Br
3022	Et ₃ CC≡C	H	O	Br
3023	Et ₃ CC≡C	H	S	Br
3024	Et ₃ CC≡C	Me	O	Br
3025	Et ₃ CC≡C	Cl	O	Br

【0071】

[0071]

【表 45】

[Table 45]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
3026	Me	H	NMe	Cl
3027	Et	H	O	Cl
3028	n-Pr	Me	O	Cl
3029	n-Bu	Me	O	Cl
3030	i-Bu	Cl	O	Cl
3031	sec-Bu	Cl	O	Cl
3032	n-Pent	H	NMe	Cl
3033	n-Hex	H	O	Cl
3034	n-ヘプチル	H	O	Cl
3035	n-オクチル	Me	O	Cl
3036	n-ノニル	H	NMe	Cl
3037	n-デシル	H	NMe	Cl
3038	t-Bu	H	NMe	Cl
3039	EtC(Me)	Me	O	Cl
3040	i-PrC(Me)	Me	O	Cl
3041	t-BuCH ₂	Me	O	Cl
3042	t-BuC(Me) ₂	H	NMe	Cl
3043	t-Bu(CH ₂) ₃	H	NMe	Cl
3044	t-BuC(Me) ₂ CH ₂	H	NMe	Cl
3045	t-Bu(CH ₂) ₃	H	NMe	Cl
3046	n-Pr	H	NMe	Br
3047	sec-Bu	H	O	Br
3048	EtC(Me)	H	O	Br
3049	t-Bu	Me	O	Br
3050	t-BuCH ₂	Me	O	Br

【0072】

[0072]

【表 46】

[Table 46]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
3076	H ₂ C=CH	H	NMe	Cl
3077	MeCH=CH	H	O	Cl
3078	EtCH=CH	H	S	Cl
3079	n-PrCH=CH	Cl	O	Cl
3080	n-BuCH=CH	Me	O	Cl
3081	n-PentCH=CH	Cl	O	Cl
3082	n-HexCH=CH	Br	O	Cl
3083	n-ヘプチル-CH=CH	H	O	Cl
3084	n-オクチル-CH=CH	H	O	Cl
3085	Me ₂ C=CH	Cl	S	Cl
3086	Me ₂ C=C (Me)	Me	O	Br
3087	MeCH=C (Me)	Me	O	Cl
3088	Cl ₂ C=CH	Cl	O	Cl
3089	Cl ₂ C=C (Me)	Me	O	Cl
3090	Cl ₂ C=C (Cl)	H	O	Cl
3091	PhCH ₂ CH=CH	H	O	Cl
3092	PhCH ₂ CH=C (Me)	H	S	Cl
3093	PhCH ₂ C(Me)=C(Me)	H	NMe	Cl
3094	MeOCH=CH	H	O	Cl
3095	EtOCH=CH	H	O	Cl
3096	n-PrOCH=CH	Me	O	Cl
3097	n-BuOCH=CH	H	O	Cl
3098	i-PrOCH=CH	H	O	Cl
3099	t-BuOCH=CH	H	O	Cl
3100	PhOCH=CH	H	O	Cl

【0073】

[0073]

【表 47】

[Table 47]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
3101	MeOCH=C (Me)	Me	O	Cl
3102	EtOCH=C (Me)	H	NMe	Cl
3103	n-PrOCH=C (Me)	H	S	Cl
3104	n-BuOCH=C (Me)	H	O	Br
3105	i-PrOCH=C (Me)	H	O	Cl
3106	t-BuOCH=C (Me)	H	O	Cl
3107	PhOCH=C (Me)	Cl	O	Cl
3108	MeOC(Me)=C(Me)	H	NMe	Cl
3109	EtOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
3110	n-PrOC(Me)=C(Me)	H	O	Cl
3111	n-BuOC(Me)=C(Me)	Me	O	Cl
3112	i-PrOC(Me)=C(Me)	H	O	Cl
3113	t-BuOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
3114	PhOC(Me)=C(Me)	H	S	Cl
3115	MeOC(O)CH=CH	Me	O	Cl
3116	MeOC(O)C(Me)=CH	H	O	Br
3117	MeOC(O)CH=C(Me)	Me	O	Cl
3118	MeOC(O)C(Me)=C(Me)	Cl	O	Cl
3119	MeOC(O)C(Cl)=C(Me)	Cl	O	Cl
3120	MeOC(O)C(Br)=C(Me)	H	NMe	Cl
3121	MeOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	Cl
3122	EtOC(O)CH=C(Me)	H	O	Cl
3123	EtOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	Cl
3124	EtOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	Cl
3125	i-PrOC(O)CH=C(Me)	Me	O	Cl

【0074】

[0074]

【表 48】

[Table 48]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
3126	i-PrOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	C 1
3127	i-PrOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	C 1
3128	t-BuOC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
3129	t-BuOC(O)C(Cl)=C(Me)	H	O	C 1
3130	t-BuOC(O)C(F)=C(Me)	Me	O	C 1
3131	MeOC(O)C(CO ₂ Me)=C(Me)	H	O	C 1
3132	MeOC(O)C(CN)=C(Me)	Me	O	C 1
3133	EtOC(O)C(CO ₂ Et)=C(Me)	C 1	O	C 1
3134	MeOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
3135	EtOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
3136	PhCH=C(Me)	Me	O	C 1
3137	BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
3138	4-Me-BnOCH=C(Me)	H	O	C 1
3139	3-Me-BnOCH=C(Me)	H	O	C 1
3140	2-Me-BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
3141	3,4-Me ₂ -BnOCH=C(Me)	Me	O	C 1
3142	PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
3143	4-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
3144	3-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
3145	2-Me-PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
3146	2,5-Me ₂ -PhOCH ₂ CH=C(Me)	H	O	C 1
3147	3,4-Me ₂ -PhOCH ₂ CH=C(Me)	Me	O	C 1
3148	Me ₂ NC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
3149	(n-Bu) ₂ NC(O)CH=C(Me)	H	O	C 1
3150	Me ₂ NC(O)OCH=C(Me)	Me	O	C 1

【0075】

[0075]

【表 49】

[Table 49]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
3151	1-シクロヘキセニル	Me	O	Cl
3152	Py-2-イル	H	NMe	Cl
3153	Py-3-イル	H	NMe	Cl
3154	Py-4-イル	H	S	Cl
3155	6-Cl-Py-2-イル	Me	O	Cl
3156	6-Cl-Py-3-イル	Me	O	Cl
3157	2,6-Cl ₂ -Py-3-イル	H	S	Cl
3158	2-チエニル	Me	O	Cl
3159	3-チエニル	H	NMe	Br
3160	2-フリル	Cl	O	Cl
3161	3-フリル	Cl	O	Br
3162	2-ベンゾチエニル	H	S	Cl
3163	3-ベンゾチエニル	H	NMe	Cl
3164	5-MeO-2-Py	Me	O	Cl
3165	ピロール-1-イル	H	S	Cl
3166	2-ピリミジニル	H	S	Cl
3167	4-ピリミジニル	Cl	O	Cl
3168	1-ピラゾリル	Cl	O	Cl
3169	5-チアゾリル	H	NMe	Cl
3170	5-オキサゾリル	H	NMe	Cl
3171	1-インドリル	Me	O	Cl
3172	2-キノリニル	Me	O	Cl
3173	3-ピリダジニル	H	S	Cl
3174	ピリジン-2-オン-1-イル	Me	O	Cl
3175	ピリジン-3-オン-1-イル	Me	O	Cl

【0076】

[0076]

【表 50】

[Table 50]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
3176	PhO	H	NMe	Br
3177	4-Me-PhO	Me	O	Cl
3178	3-Me-PhO	H	NMe	Br
3179	2-Me-PhO	Me	O	Cl
3180	3, 4-Me-PhO	Me	O	Cl
3181	2, 5-Me-PhO	H	S	Br
3182	4-Cl-PhO	H	S	Br
3183	2-PyO	Me	O	Cl
3184	5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ	Me	O	Cl
3185	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルオキシ	Me	O	Cl
3186	4-CF ₃ -PhO	Me	O	Cl
3187	ピリミジン-4-イルオキシ	Cl	O	Cl
3188	6-Cl-ピリミジン-4-イルオキシ	Me	O	Cl
3189	2-シアノ-PhO	Me	O	Cl
3190	ピリミジン-2-イルオキシ	H	S	Br
3191	Py-2-イルオキシ	H	NMe	Br
3192	5-Py-2-イルオキシ	H	NMe	Cl
3193	2-ニトロ-PhO	H	NMe	Br
3194	BnO	Me	O	Cl
3195	4-Me-BnO	Me	O	Cl
3196	アリルオキシ	Me	O	Cl
3197	プロパルギルオキシ	Me	O	Cl
3198	シクロプロピルメチルオキシ	Me	O	Cl
3199	i-PrO	H	NMe	Br
3200	t-BuO	Cl	O	Cl

【0077】

[0077]

【表 51】

[Table 51]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
3201	PhNH	H	NMe	Br
3202	5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ	H	S	Cl
3203	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルアミノ	H	NMe	Cl
3204	PhS	Me	O	Cl
3205	4-Me-PhS	Me	O	Cl
3206	3-Me-PhS	Me	O	Cl
3207	2-Me-PhS	Me	O	Cl
3208	3, 4-Me ₂ -PhS	Me	O	Cl
3209	BnS	Me	O	Cl
3210	4-Me-BnS	Me	O	Cl
3211	3-Me-BnS	Me	O	Cl
3212	2-Me-BnS	Me	O	Cl
3213	3, 4-Me ₂ -BnS	Me	O	Br
3214	Py-2-イルチオ	H	S	Cl
3215	5-CF ₃ -Py-2-イルチオ	Me	O	Cl
3216	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イルチオ	Me	O	Cl
3217	ピリミジン-4-イルチオ	H	S	Cl
3218	ピリミジン-2-イルチオ	H	NMe	Cl
3219	N-(5-CF ₃ -Py-2-イル)-N-Me-アミノ	Me	O	Cl
3220	N-(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-イル)-N-Me-アミノ	Cl	O	Cl
3221	n-PrS	Cl	O	Cl
3222	t-BuS	Me	O	Cl
3223	5-MeO-Py-2-イルチオ	H	S	Br
3224	シクロプロピルメチルチオ	Me	O	Cl
3225	プロパルギルチオ	Me	O	Cl

【0078】

[0078]

【表 52】

[Table 52]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
3226	MeON=C(Me)	H	NMe	Cl
3227	EtON=C(Me)	H	NMe	Br
3228	n-PrON=C(Me)	Me	O	Cl
3229	i-PrON=C(Me)	Me	O	Cl
3230	n-BuON=C(Me)	Me	O	Cl
3231	i-BuON=C(Me)	Me	O	Cl
3232	sec-BuON=C(Me)	Me	O	Cl
3233	n-Pent-ON=C(Me)	Me	O	Cl
3234	n-Hex-ON=C(Me)	Me	O	Cl
3235	n- ⁷ flu-ON=C(Me)	Me	O	Cl
3236	c-PrCH ₂ N=C(Me)	Me	O	Cl
3237	c-PentCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
3238	t-BuCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
3239	BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3240	4-Me-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3241	3-Me-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3242	2-Me-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3243	3,4-Me ₂ -BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3244	2,5-Me ₂ -BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3245	4-Cl-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3246	3-Cl-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3247	2-Cl-BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3248	3,4-Cl ₂ -BnON=C(Me)	Me	O	Cl
3249	HC≡CCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl
3250	H ₂ C=CHCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	Cl

【0079】

[0079]

【表 53】

[Table 53]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
3251	MeOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3252	EtOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3253	PhCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3254	Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
3255	Ph(CH ₂) ₄ ON=C(Me)	Me	O	C1
3256	PhOCH ₂ CH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3257	PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
3258	4-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3259	2-Me-Ph(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3260	4-Me-Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
3261	2-Me-Ph(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
3262	4-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3263	2-Me-PhO(CH ₂) ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3264	4-Me-PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
3265	2-Me-PhO(CH ₂) ₃ ON=C(Me)	Me	O	C1
3266	PhCH(Me)ON=C(Me)	Me	O	C1
3267	4-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)	Me	O	C1
3268	2-Me-PhCH(Me)ON=C(Me)	Me	O	C1
3269	2-シアノ-PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3270	2-MeOC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3271	2-MeNHC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3272	2-Me ₂ NC(O)PhCH ₂ ON=C(Me)	Me	O	C1
3273	PhCH(CN)ON=C(Me)	Me	O	C1
3274	PhCH(COOMe)ON=C(Me)	Me	O	C1
3275	PhCH(OMe)ON=C(Me)	Me	O	C1

【0080】

[0080]

【表 54】

[Table 54]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
3276	$\text{IC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3277	$\text{MeC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3278	$\text{EtC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3279	$\text{n-PrC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3280	$\text{n-BuC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3281	$\text{t-BuC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3282	$\text{Me}_3\text{SiC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3283	$\text{PhC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3284	$\text{Et}_3\text{CC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3285	$\text{PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3286	$4\text{-Me-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3287	$3\text{-Me-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3288	$4\text{-MeO-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3289	$4\text{-Me-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3290	$2\text{-Py-ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3291	$5\text{-CF}_3\text{-Py-2-ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3292	$3\text{-Cl-5-CF}_3\text{-Py-2-ON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3293	$3,4\text{-Me}_2\text{-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3294	$2,5\text{-Me}_2\text{-PhON}=\text{C}(\text{Me})$	Me	O	C l
3295	$\text{BnON}=\text{CH}$	H	S	Br
3296	$\text{PhON}=\text{CH}$	H	NMe	Br
3297	$\text{Ph(CH)}_2\text{ON}=\text{CH}$	H	NMe	Br
3228	$\text{HC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{CH}$	H	O	Br
3299	$\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2 \text{ON}=\text{CH}$	H	O	Br
3300	$\text{MeC} \equiv \text{CCH}_2 \text{ON}=\text{CH}$	H	S	Br

【0081】

[0081]

【表 55】

[Table 55]

番号	R ¹	R ²	X	R ³
3301	MeSC(Me)=N	Me	O	Cl
3302	EtSC(Me)=N	H	S	Br
3303	n-PrSC(Me)=N	Me	O	Cl
3304	n-BuSC(Me)=N	H	NMe	Cl
3305	MeSC(Et)=N	H	NMe	Cl
3306	MeSC(n-Pr)=N	Me	O	Cl
3307	MeSC(n-Bu)=N	Cl	O	Br
3308	MeSC(c-Pr)=N	Me	O	Cl
3309	MeSC(c-Pent)=N	NMe	NMe	Br
3310	MeSC(c-Hex)=N	Cl	O	Cl
3311	BnSC(Me)=N	Me	O	Cl
3312	BnSC(Et)=N	H	NMe	Cl
3313	BnSC(n-Pr)=N	Cl	O	Cl
3314	BnSC(n-Bu)=N	H	S	Br
3315	BnSC(c-Pr)=N	Me	O	Cl
3316	BnSC(t-Bu)=N	H	S	Cl
3317	BnSC(c-Pent)=N	Cl	O	Br
3318	BnSC(c-Hex)=N	H	O	Cl
3319	BnSC(Ph)=N	Me	O	Cl
3320	MeSC(Ph)=N	H	O	Br
3321	EtSC(Ph)=N	Me	O	Cl
3322	n-PrSC(Ph)=N	H	NMe	Cl
3323	i-BuSC(Me)=N	Cl	O	Cl
3324	sec-BuSC(Me)=N	H	S	Cl
3325	Ph(CH ₂) ₂ SC(Me)=N	Me	O	Cl

【0082】

[0082]

【表 56】

[Table 56]

番号	R ¹	R ^a	X	R ²
3326	Me SC (SMe) =N	Me	O	Cl
3327	Et SC (SMe) =N	H	NMe	Br
3328	n-Pr SC (SMe) =N	Me	O	Cl
3329	n-Bu SC (SMe) =N	H	NMe	Br
3330	Bn SC (SMe) =N	Me	O	Cl
3331	c-PrCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3332	n-PrSC(S-n-Pr)=N	H	S	Br
3333	n-PrSC(SEt)=N	Cl	O	Br
3334	c-PentCH ₂ SC(SMe)=N	H	NMe	Cl
3335	EtSC(SEt)=N	H	S	Br
3336	n-BuSC(S-n-Bu)=N	H	S	Cl
3337	HC≡CCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3338	H ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3339	Me ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3340	MeC≡CCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3341	Cl ₂ C=CHCH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3342	2-Me-BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
3343	4-Me-BnSC(SMe)=N	Me	O	Cl
3344	MeOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3345	EtOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3346	i-PrOC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3347	Me ₂ NC(O)CH ₂ SC(SMe)=N	Me	O	Cl
3348	i-BuSC(SMe)=N	Me	O	Cl
3349	sec-BuSC(SMe)=N	Me	O	Cl
3350	BnSC(S-i-Bu)=N	Me	O	Cl

【0083】

尚、上記の表において、Me はメチル基を、Et はエチル基を、Pr はプロピル基を、Bu はブチル基を、Pent はペンチル基を、Hex はヘキシル基を、Ph はフェニル基を、Py はピリジル基を、Bn はベンジル基を意味する。

また、n-はノルマル-を、i-はイソ-を、sec-はセカンダリー-を、t-はターシャリー-を、c-はシクロ-の意味を表わす。

【0084】

【0083】

Furthermore as for Me methyl group, as for Et ethyl group asfor Pr propyl group, as for Bu butyl group, as for Pent pentyl group, as for Hex hexyl group, as for Ph phenyl group, asfor Py pyridyl group as for Bn benzyl group is meant in theabove-mentioned chart.

In addition, as for n- normal -, as for i- iso -,as for s - secondary -, as for t- tertiary -, as for the c- meaning of cyclo - is displayed.

【0084】

次に製剤例を示す。

なお、部は重量部を表わし、本発明化合物は表 1 から表 56 に記載の化合物番号で示す。

製剤例 1

本発明化合物 1~350、1001~1350、2001~2350 及び 3001~3350 の各々 50 部、リグニンスルホン酸カルシウム 3 部、ラウリル硫酸ナトリウム 2 部及び合成含水酸化珪素 45 部をよく粉碎混合することにより、各々の水和剤を得る。

製剤例 2

本発明化合物 1~350、1001~1350、2001~2350 及び 3001~3350 の各々 25 部、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレート 3 部、CMC3 部及び水 69 部を混合し、有効成分の粒度が 5 ミクロン以下になるまで湿式粉碎することにより、各々の懸濁剤を得る。

【0085】

製剤例 3

本発明化合物 1~350、1001~1350、2001~2350 及び 3001~3350 の各々 2 部、カオリンクレ-88 部及びタルク 10 部をよく粉碎混合することにより、各々の粉剤を得る。

製剤例 4

本発明化合物 1~350、1001~1350、2001~2350 及び 3001~3350 の各々 20 部、ポリオキシエチレンステリルフェニルエ-テル 14 部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部及びキシレン 60 部をよく混合することにより、各々の乳剤を得る。

【0086】

製剤例 5

本発明化合物 1~350、1001~1350、2001~2350 及び 3001~3350 の各々 2 部、合成含水酸化珪素 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部及びカオリンクレ-65 部をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥することにより、各々の粒剤を得る。

製剤例 6

本発明化合物 1~350、1001~1350、2001~2350 及び 3001~3350 の各々 20 部とソルビタントリオレート 1.5 部とを、ポリビニルアルコール 2 部を含む水溶液 28.5 部と混合し、サンドグラインダーで微粉碎(粒径 3 μ 以下)した後、この中に、キサン

Formulation Example is shown next.

Furthermore, part displays parts by weight, shows the compound of this invention with the compound number which from Table 1 is stated in Table 5 6.

Formulation Example 1

Each wettable is obtained each 50 sections of the compound of this invention 1~350, 1001~1350, 2001~2350 and 3001 - 3350, by well powder fragment mixing calcium lignin sulfonate 3 part, sodium lauryl sulfate 2 part and synthetic hydrated silicon oxide 45 section.

Formulation Example 2

Until each 25 sections of the compound of this invention 1~350, 1001~1350, 2001~2350 and 3001 - 3350, polyoxyethylene sorbitan mono oleate 3 part, CMC 3 part and the water 69 section are mixed, granularity of active ingredient becomes 5 micron or less, each suspension is obtained by wet milling doing.

【0085】

Formulation Example 3

Each powder is obtained by each 2 part, kaolin clay 88 sections and talc 10 part of the compound of this invention 1~350, 1001~1350, 2001~2350 and well powder fragment mixing 3001 - 3350.

Formulation Example 4

Each emulsion is obtained each 20 sections of the compound of this invention 1~350, 1001~1350, 2001~2350 and 3001 - 3350, by mixing polyoxyethylene styryl phenyl ether 14 part, calcium dodecylbenzene sulfonate 6 part and xylene 60 section well.

【0086】

Formulation Example 5

Each 2 part, synthetic hydrated silicon oxide 1 part, calcium lignin sulfonate 2 part, bentonite of the compound of this invention 1~350, 1001~1350, 2001~2350 and 3001 - 3350 (DANA 71.3.1a.1-2) powder fragment it mixes 30 sections and kaolin clay 65 section well, adding water kneads well and after adjusting, it obtains each granule granulating by drying.

Formulation Example 6

Each 20 sections and sorbitan trioleate 1.5 part of the compound of this invention 1~350, 1001~1350, 2001~2350 and it mixes 3001 - 3350, with aqueous solution 28.5 part which includes poly vinyl alcohol 2 part, with sand grinder fine pulverization after (particle diameter 3 μ or less), in

タンガム 0.05 部及びアルミニウムマグネシウムシリケート 0.1 部を含む水溶液 40 部を加え、さらにプロピレングリコール 10 部を加えて攪拌混合し各々の 20%水中懸濁剤を得る。

製剤例 7

本発明化合物 1~350、1001~1350、2001~2350 及び 3001~3350 の各々 0.1 部をキシレン 5 部及びトリクロロエタン 5 部に溶解し、これを脱臭灯油 89.9 部に混合して各々の 0.1%油剤を得る。

【0087】

次に、本発明化合物が農園芸用殺菌剤として有用であることを試験例で示す。

なお、本発明化合物は表 1~表 56 に記載の化合物番号で示す。

本発明化合物の防除効果は、調査時の供試植物上の病斑の面積を肉眼観察し、無処理区の病斑の面積と本発明化合物処理区の病斑の面積を比較することにより評価した。

【0088】

試験例 1:イネいもち病防除試験(予防効果)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、イネ(日本晴)を播種し、温室内で 20 日間生育させた。

その後、本発明化合物 239 を製剤例 1 に準じて水和剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、そのイネ葉面に充分付着するように茎葉散布した。

散布後、植物を風乾し、いもち病菌の懸濁液を噴霧接種した。

接種後 28 deg C、多湿下に 6 日間置いた後、防除効果を調査した。

その結果、本発明化合物 239 処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の 30%以下であった。

【0089】

試験例 2:コムギうどんこ病防除試験(治療効果)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ(農林 73 号)を播種し、温室内で 10 日間生育させた。

第 2 葉が展開したそのコムギの幼苗にコムギうどんこ病菌胞子をふりかけ接種した。

接種後、23 deg C の温室に 2 日間置いた。

this , it agitates it mixes including xanthan gum 0.05 section and aqueous solution 40 section which includes aluminum magnesium silicate 0.1 part , furthermoreincluding propylene glycol 10 part and obtains each 20% suspension in water .

Formulation Example 7

Each 0.1 part of the compound of this invention 1~350, 1001~1350, 2001~2350 and 3001 - 3350 are melted in xylene 5 part and trichloroethane 5 part , this is mixed to deodorized illuminating oil 89.9 part and each 0.1% oil isobtained.

【0087】

Next, the compound of this invention fact that it is useful as horticultural microbicide is shown with Test Example .

Furthermore, it shows the compound of this invention with compound number which is stated in the Table 1 ~Table 5 6.

protective effect of the compound of this invention visual observation did surface area of diseased spot on the test plant when investigating, evaluation did with surface area of diseased spot of untreated plot and comparing surface area of diseased spot of the compound of this invention treated plot .

【0088】

Test Example 1:rice blast protection test (preventive effect)

It stuffed sandy soil to plastic pot , seeding did rice (Nipponbare), 20 day grew inside greenhouse .

After that, after designating the compound of this invention 239 as wettable according to the Formulation Example 1, it diluted with water and made specified concentration (500 ppm), in order that,satisfactory to deposit in rice leaf surface , foliage spreading it did.

after spreading , plant air dry was done, suspension of rice blast microbe atomization inoculation wasdone.

6 day after putting under 28 deg C, high humidity after inoculation , protective effect wasinvestigated.

As a result, diseased spot surface area on plant of the compound of this invention 239treated plot was 30% or less of the diseased spot surface area of untreated plot .

【0089】

Test Example 2:wheat powdery mildew protection test (remedial effect)

It stuffed sandy soil to plastic pot , seeding did wheat (Norin 73 number), 10 day grew inside greenhouse .

It sprinkled wheat powdery mildew microbe spore to sprout of wheat which 2 nd leaf developand inoculation did.

After inoculation , 2 day you put in greenhouse of 23 deg C.

本発明化合物 239 を製剤例 2 に準じて懸濁剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、うどんこ病菌が接種されているコムギ葉面に充分付着するように茎葉散布した。

散布後さらに照明下に 7 日間置いた後、防除効果を調査した。

その結果、本発明化合物 239 処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の 30%以下であった。

【0090】

試験例 3:コムギ赤さび病防除試験(予防効果)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、コムギ(農林 73 号)を播種し、温室内で 10 日間生育させた。

本発明化合物 239 を製剤例 4 に準じて乳剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、そのコムギ葉面に充分付着するように茎葉散布した。

散布後植物を風乾し、コムギ赤さび病菌の胞子を接種した。

接種後はじめは 23 deg C、暗黒多湿下に 1 日置き、さらに照明下に 6 日間置いた後、防除効果を調査した。

その結果、本発明化合物 239 処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の 30%以下であった。

【0091】

試験例 4:キュウリ灰色かび病防除効果試験(予防効果)

プラスチックポットに砂壤土を詰め、キュウリ(相模半白)を播種し、温室内で 12 日間生育させた。

本発明化合物 239 を製剤例 1 に準じて水和剤とした後、水で希釈し所定濃度(500ppm)にし、それを、そのキュウリ葉面に充分付着するように茎葉散布した。

散布後植物を風乾し、キュウリ灰色かび病菌の菌糸含有 PDA 培地をキュウリ葉面上に置いた。

接種後 10 deg C、多湿下に 4 日置いた後、防除効果を調査した。

After designating the compound of this invention 239 as suspension according to Formulation Example 2, it diluted with water and made specified concentration (500 ppm), in order that, powdery mildew microbe satisfactory to deposit in wheat leaf surface which inoculation is done, foliage spreading it did.

after spreading furthermore 7 day after putting under illumination, protective effect was investigated.

As a result, diseased spot surface area on plant of the compound of this invention 239 treated plot was 30% or less of the diseased spot surface area of untreated plot.

[0090]

Test Example 3:wheat red rust protection test (preventive effect)

It stuffed sandy soil to plastic pot, seeding did wheat (Norin 73 number), 10 day grew inside greenhouse.

After designating the compound of this invention 239 as emulsion according to Formulation Example 4, it diluted with water and made specified concentration (500 ppm), in order that, satisfactory to deposit in wheat leaf surface, foliage spreading it did.

after spreading plant air dry was done, spore of wheat red rust microbe inoculation was done.

After inoculation * * 1 day you put under 23 deg C, darkness high humidity, furthermore 6 day after putting under illumination, you investigated protective effect.

As a result, diseased spot surface area on plant of the compound of this invention 239 treated plot was 30% or less of the diseased spot surface area of untreated plot.

[0091]

Test Example 4:cucumber gray mold of fruit protective effect test (preventive effect)

It stuffed sandy soil to plastic pot, seeding did cucumber (Sagamihara Hanshiro), 12 day grew inside greenhouse.

After designating the compound of this invention 239 as wettable according to Formulation Example 1, it diluted with water and made specified concentration (500 ppm), in order that, satisfactory to deposit in cucumber leaf surface, foliage spreading it did.

after spreading plant air dry was done, achromatic content PDA culture medium of cucumber gray mold of fruit microbe was put on cucumber leaf surface.

4 Hioki after being, protective effect was investigated under 10 deg C, high humidity after inoculation.

その結果、本発明化合物 239 処理区の植物上の病斑面積は、無処理区の病斑面積の 30%以下であった。

【0092】

【発明の効果】

本発明化合物は、優れた農園芸用殺菌効力を有する。

As a result, diseased spot surface area on plant of the compound of this invention 239 treated plot was 30% or less of the diseased spot surface area of untreated plot .

[0092]

[Effects of the Invention]

the compound of this invention has horticultural sterilization effect which is superior.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.